

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局



(43) 国際公開日
2003 年 10 月 30 日 (30.10.2003)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 03/089433 A1

(51) 国際特許分類: C07D 487/04, A01N 43/90

(21) 国際出願番号: PCT/JP03/02014

(22) 国際出願日: 2003 年 2 月 25 日 (25.02.2003)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:
特願2002-117279 2002 年 4 月 19 日 (19.04.2002) JP

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 住友化学工業株式会社 (SUMITOMO CHEMICAL COMPANY, LIMITED) [JP/JP]; 〒541-8550 大阪府 大阪市 中央区北浜四丁目 5 番 3 3 号 Osaka (JP).

(72) 発明者; および
(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 池上 宏 (IKEGAMI, Hiroshi) [JP/JP]; 〒561-0802 大阪府 豊中市 曽根東町 2-1 0-4-4 2 0 Osaka (JP).

(74) 代理人: 榎本 雅之, 外 (ENOMOTO, Masayuki et al.); 〒541-8550 大阪府 大阪市 中央区北浜四丁目 5 番 3 3 号 住友化学知的財産センター株式会社内 Osaka (JP).

(81) 指定国 (国内): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, KE, KG, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

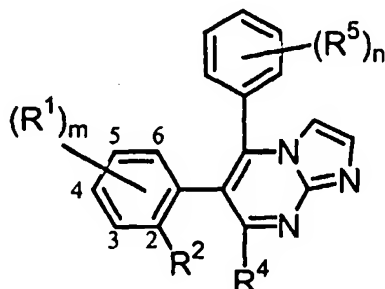
(84) 指定国 (広域): ARIPO 特許 (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア特許 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ特許 (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, SI, SK, TR), OAPI 特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:
— 国際調査報告書

2 文字コード及び他の略語については、定期発行される各 PCT ガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

(54) Title: 5,6-DIPHENYLIMIDAZO[1,2-a]PYRIMIDINE AND BACTERICIDAL COMPOSITION CONTAINING THE SAME

(54) 発明の名称: 5, 6-ジフェニルイミダゾ [1, 2-a] ピリミジン及びこれを含有する殺菌組成物



(1)

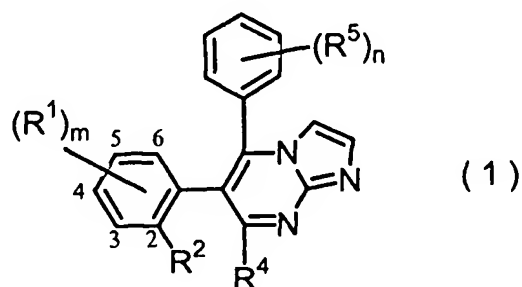
(57) Abstract: An imidazopyrimidine represented by the following formula (1): (1) wherein R¹ and R² each represents halogeno; R⁴ represents halogeno, etc.; R⁵ represents halogeno, nitro, etc.; m is an integer of 0 to 4; n is an integer of 0 to 5; and when m is an integer of 2 or larger, then R¹'s may be the same or different atoms, and when n is an integer of 2 or larger, then R⁵'s may be the same or different atoms or groups. It has excellent bactericidal activity against plant diseases.

[続葉有]



(57) 要約:

下式 (1)



[式中、 R^1 および R^2 はハロゲン原子を表し、 R^4 はハロゲン原子等を表し、 R^5 はハロゲン原子、ニトロ基等を表し、 m は0～4の整数を表し、 n は0～5の整数を表す。 m が2以上の整数の場合、 R^1 は互いに同一または相異なる原子を表してもよく、 n が2以上の整数の場合、 R^5 は互いに同一または相異なる原子または基を表してもよい。]

で示されるイミダゾピリミジン、植物病害に対する優れた防除活性を有する。

明 細 書

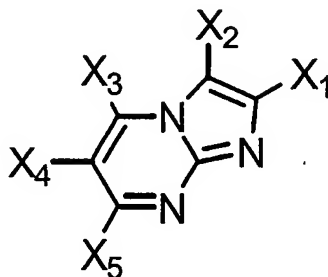
5, 6-ジフェニルイミダゾ [1, 2-a] ピリミジン及びこれを含有する殺菌組成物

5 技術分野

本発明は、5, 6-ジフェニルイミダゾ [1, 2-a] ピリミジン及びこれを含有する殺菌組成物に関する。

背景技術

- 10 日本公開特許公報の特開2001-43978号には、下式で示されるイミダゾ [1, 2-a] ピリミジン



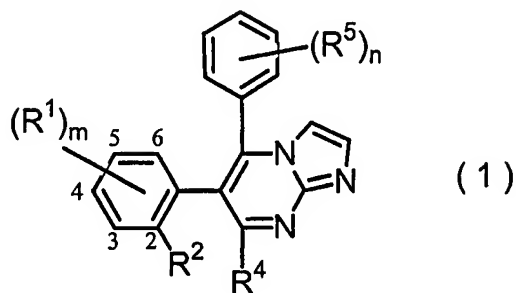
- [式中、 $X_1 \sim X_5$ は水素原子、ハロゲン原子、直鎖、分岐または環状のアルキル基、直鎖、分岐または環状のアルコキシ基、置換または未置換のアラルキル基、
- 15 置換または未置換のアリール基、置換または未置換のアラルキルオキシ基、あるいは置換または未置換のアリールオキシ基を表し、さらに、 X_1 と X_2 、 X_3 と X_4 、および X_4 と X_5 から選ばれる隣接する基は互いに結合して、置換している炭素原子と共に、置換または未置換の炭素環式脂肪族環、あるいは置換または未置換の炭素環式芳香族環を形成してもよい。]
- 20 が有機電界発光素子の材料として有効であることが記載されている。
- 本発明は、植物病害に対する優れた防除活性を有する新規なイミダゾ [1, 2-a] ピリミジンを提供することを課題とする。

発明の開示

- 25 本発明者は、鋭意検討した結果、式(1)で示される5, 6-ジフェニルイミ

ダゾ[1, 2-a]ピリミジンが優れた植物病害防除効果を有することを見出し、本発明に至った。

即ち、本発明は、下式(1)



- 5 [式中、 R^1 および R^2 はハロゲン原子を表し、 R^4 はハロゲン原子、C1-C4アルキル基、C1-C4アルコキシ基またはシアノ基を表し、 R^5 はハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、C1-C4アルキル基、C1-C4アルコキシ基、C1-C4アルキルチオ基、C1-C4ハロアルキルチオ基、C1-C4ハロアルキル基、C1-C4ハロアルコキシ基、C1-C4アシル基、C2-C5アルコキシカルボニル基またはフェニル基を表し、 m は0~4の整数を表し、 n は0~5の
- 10 整数を表す。 m が2以上の整数の場合、 R^1 は互いに同一または相異なる原子を表してもよく、 n が2以上の整数の場合、 R^5 は互いに同一または相異なる原子または基を表してもよい。]

- で示されるイミダゾピリミジン(以下、本発明化合物と記す。)、本発明化合物を
- 15 有効成分として含有する殺菌組成物、および本発明化合物を植物または土壤に施用する植物病害防除方法を提供する。

本発明において、 R^1 、 R^2 、 R^4 または R^5 で示される各置換基の具体的な例を以下に例示する。

- 20 R^1 および R^2 で示されるハロゲン原子としては、例えばフッ素原子および塩素原子があげられ、
- R^4 で示されるハロゲン原子としては例えば塩素原子および臭素原子があげられ、C1-C4アルキル基としては例えばメチル基、エチル基、プロピル基およびイソプロピル基があげられ、

R⁴で示されるC 1－C 4アルコキシ基としては例えば、メトキシ基、エトキシ基、プロピルオキシ基およびイソプロピルオキシ基があげられ、

R⁵で示されるハロゲン原子としては例えばフッ素原子、塩素原子および臭素原子があげられ、

- 5 R⁵で示されるC 1－C 4アルキル基としてはメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、sec-ブチル基、イソブチル基およびtert-ブチル基があげられ、

R⁵で示されるC 1－C 4アルコキシ基としては例えばメトキシ基、エトキシ基、プロポキシ基、イソプロポキシ基およびブトキシ基があげられ、

- 10 R⁵で示されるC 1－C 4アルキルチオ基としては例えばメチルチオ基、エチルチオ基、プロピルチオ基およびイソプロピルチオ基があげられ、

R⁵で示されるC 1－C 4ハロアルキルチオ基としては例えばトリフロロメチルチオ基、1, 1, 2, 2-テトラフルオロエチルチオ基があげられ、

R⁵で示されるC 1－C 4ハロアルキル基としては例えばトリフルオロメチル基

- 15 があげられ、

R⁵で示されるC 1－C 4ハロアルコキシ基としては例えばトリフルオロメトキシ基および1, 1, 2, 2-テトラフルオロエトキシ基があげられ、

R⁵で示されるC 1－C 4アシル基としては例えばホルミル基、アセチル基およびプロピオニル基があげられ、

- 20 R⁵で示されるC 2－C 5アルコキシカルボニル基としては例えばメトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、プロポキシカルボニル基、イソプロポキシカルボニル基およびブトキシカルボニル基があげられる。

式(1)における(R¹)_nおよびR²が置換したフェニル基としては、例えば2-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、2, 3-ジフルオロフェニル基、

- 25 2, 3-ジクロロフェニル基、2, 4-ジフルオロフェニル基、2-クロロ-4-フルオロフェニル基、4-クロロ-2-フルオロフェニル基、2, 4-ジクロロフェニル基、2, 5-ジフルオロフェニル基、2, 5-ジクロロフェニル基、2, 6-ジフルオロフェニル基、2-クロロ-6-フルオロフェニル基、2, 6-ジクロロフェニル基、2, 3, 4-トリフルオロフェニル基、2, 3, 5-トリ

リフルオロフェニル基、2, 4, 5-トリフルオロフェニル基、2, 3, 6-トリフルオロフェニル基、2, 4, 6-トリフルオロフェニル基、2-クロロ-4, 6-ジフルオロフェニル基、4-クロロ-2, 6-ジフルオロフェニル基、2, 4-ジクロロ-6-フルオロフェニル基、2, 6-ジクロロ-4-フルオロフェニル基、2, 4, 6-トリクロロフェニル基、2, 3, 4, 5-テトラフルオロフェニル基、2, 3, 4, 6-テトラフルオロフェニル基、2, 3, 5, 6-テトラフルオロフェニル基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニル基および4-クロロ-2, 3, 5, 6-テトラフルオロフェニル基があげられ、式(1)における(R⁵)_nが置換したフェニル基としては、例えばフェニル基、4-メチルフェニル基、3-メチルフェニル基、2-メチルフェニル基、4-エチルフェニル基、4-プロピルフェニル基、4-イソプロピルフェニル基、4-ブチルフェニル基、4-sec-ブチルフェニル基、4-イソブチルフェニル基、4-tert-ブチルフェニル基、2, 3-ジメチルフェニル基、2, 4-ジメチルフェニル基、2, 5-ジメチルフェニル基、3, 4-ジメチルフェニル基、3, 5-ジメチルフェニル基、4-フェニルフェニル基、4-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、2-クロロフェニル基、4-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、2-フルオロフェニル基、2, 3-ジクロロフェニル基、2, 4-ジクロロフェニル基、2, 5-ジクロロフェニル基、3, 4-ジクロロフェニル基、3, 5-ジクロロフェニル基、2, 3-ジフルオロフェニル基、2, 4-ジフルオロフェニル基、2, 5-ジフルオロフェニル基、3, 4-ジフルオロフェニル基、3, 5-ジフルオロフェニル基、2-クロロ-4-フルオロフェニル基、4-トリフルオロメチルフェニル基、3-トリフルオロメチルフェニル基、2-トリフルオロメチルフェニル基、3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル基、4-メトキシフェニル基、3-メトキシフェニル基、2-メトキシフェニル基、2, 3-ジメトキシフェニル基、2, 4-ジメトキシフェニル基、2, 5-ジメトキシフェニル基、3, 4-ジメトキシフェニル基、3, 5-ジメトキシフェニル基、2, 3, 4-トリメトキシフェニル基、3, 4, 5-トリメトキシフェニル基、4-エトキシフェニル基、3-エトキシフェニル基、2-エトキシフェニル基、4-メチルチオフェニル基、3-メチルチオフェニル基、

- 2-メチルチオフェニル基、4-トリフルオロメトキシフェニル基、3-トリフルオロメトキシフェニル基、2-トリフルオロメトキシフェニル基、4-シアノフェニル基、3-シアノフェニル基、2-シアノフェニル基、4-ホルミルフェニル基、3-ホルミルフェニル基、2-ホルミルフェニル基、4-アセチルフェニル基、3-アセチルフェニル基、2-アセチルフェニル基、4-(メトキシカルボニル)フェニル基、4-(エトキシカルボニル)フェニル基、4-(イソプロポキシカルボニル)フェニル基および4-フルオロ-3-メチルフェニル基があげられる。
- 10 本発明化合物の態様としては例えば以下の化合物があげられる。
- 式(1)において、 R^1 がフッ素原子または塩素原子であるイミダゾピリミジン化合物；
- 式(1)において、 R^1 がフッ素原子であるイミダゾピリミジン化合物；
- 式(1)において、 R^1 が塩素原子であるイミダゾピリミジン化合物；
- 15 式(1)において、 m が0~2の整数であるイミダゾピリミジン化合物；
- 式(1)において、 m が0であるイミダゾピリミジン化合物；
- 式(1)において、 m が1であるイミダゾピリミジン化合物；
- 式(1)において、 m が2であるイミダゾピリミジン化合物；
- 式(1)において、 m が0であるか、 m が1であり、 R^1 が4位もしくは6位で置換したハロゲン原子であるか、あるいは、 m が2であり、ひとつの R^1 が4位で置換したハロゲン原子であり、もうひとつの R^1 が6位で置換したハロゲン原子であるイミダゾピリミジン化合物；
- 20 式(1)において、 m が1または2であり、少なくともひとつの R^1 が4位または6位で置換したハロゲン原子であるイミダゾピリミジン化合物；
- 25 式(1)において、 m が0であるか、あるいは、 m が1であり、 R^1 が4位で置換したハロゲン原子であるイミダゾピリミジン化合物；
- 式(1)において、 m が1であり、 R^1 が6位で置換したハロゲン原子であるか、あるいは、 m が2であり、ひとつの R^1 が4位で置換したハロゲン原子であり、もうひとつの R^1 が6位で置換したハロゲン原子であるイミダゾピリミジン化合物；

式(1)において、 m が1であり、 R^1 が6位で置換したフッ素原子もしくは塩素原子であるか、あるいは、 m が2であり、ひとつの R^1 が4位で置換したフッ素原子もしくは塩素原子であり、もうひとつの R^1 が6位で置換したフッ素原子もしくは塩素原子であるイミダゾピリミジン化合物；

- 5 式(1)において、 m が1であり、 R^1 が4位で置換したハロゲン原子であるイミダゾピリミジン化合物；

式(1)において、 m が1であり、 R^1 が6位で置換したハロゲン原子であるイミダゾピリミジン化合物；

- 10 式(1)において、 m が2であり、ひとつの R^1 が4位で置換したハロゲン原子であり、もうひとつの R^1 が6位で置換したハロゲン原子であるイミダゾピリミジン化合物；

式(1)において、 m が2であり、ひとつの R^1 が3位で置換したハロゲン原子であり、もうひとつの R^1 が6位で置換したハロゲン原子であるイミダゾピリミジン化合物；

- 15 式(1)において、 m が1であり、 R^1 が4位で置換したフッ素原子であるイミダゾピリミジン化合物；

式(1)において、 m が1であり、 R^1 が6位で置換した塩素原子であるイミダゾピリミジン化合物；

- 20 式(1)において、 m が2であり、ひとつの R^1 が4位で置換したフッ素原子であり、もうひとつの R^1 が6位で置換したフッ素原子であるイミダゾピリミジン化合物；

式(1)において、 m が2であり、ひとつの R^1 が4位で置換したフッ素原子であり、もうひとつの R^1 が6位で置換した塩素原子であるイミダゾピリミジン化合物；

- 25 式(1)において、 m が2であり、ひとつの R^1 が3位で置換したフッ素原子であり、もうひとつの R^1 が6位で置換した塩素原子であるイミダゾピリミジン化合物；

式(1)において、 m が2であり、ひとつの R^1 が4位で置換した塩素原子であり、もうひとつの R^1 が6位で置換した塩素原子であるイミダゾピリミジン化合物；

式(1)において、 R^2 がフッ素原子または塩素原子であるイミダゾピリミジン化合物；

式(1)において、 R^2 がフッ素原子であるイミダゾピリミジン化合物；

式(1)において、 R^2 が塩素原子であるイミダゾピリミジン化合物；

- 5 式(1)において、 R^1 および R^2 がそれぞれ独立してフッ素原子もしくは塩素原子であるイミダゾピリミジン化合物；

式(1)において、 R^1 および R^2 がそれぞれ独立してフッ素原子または塩素原子であり、 m が0～2の整数であるイミダゾピリミジン化合物；

- 10 式(1)において、 m が0であるか、 m が1であり、 R^1 が4位もしくは6位で置換したフッ素原子または4位もしくは6位で置換した塩素原子であるか、あるいは、 m が2であり、ひとつの R^1 が4位で置換したフッ素原子または4位で置換した塩素原子であり、もうひとつの R^1 が6位で置換したフッ素原子または6位で置換した塩素原子であり、更に R^2 がフッ素原子もしくは塩素原子であるイミダゾピリミジン化合物；

- 15 式(1)において、 m が1または2であり、少なくともひとつの R^1 が4位もしくは6位で置換したフッ素原子または4位もしくは6位で置換した塩素原子であり、 R^2 がフッ素原子または塩素原子であるイミダゾピリミジン化合物；

- 20 式(1)において、 m が1であり、 R^1 が6位で置換したフッ素原子または塩素原子であるか、あるいは、 m が2であり、ひとつの R^1 が4位で置換したフッ素原子または4位で置換した塩素原子であり、もうひとつの R^1 が6位で置換したフッ素原子または6位で置換した塩素原子であり、更に R^2 がフッ素原子または塩素原子であるイミダゾピリミジン化合物；

- 25 式(1)において、 m が1であり、 R^1 が4位で置換したフッ素原子または4位で置換した塩素原子であり、 R^2 がフッ素原子または塩素原子であるイミダゾピリミジン化合物；

式(1)において、 m が1であり、 R^1 が6位で置換したフッ素原子または6位で置換した塩素原子であり、 R^2 がフッ素原子または塩素原子であるイミダゾピリミジン化合物；

式(1)において、 m が2であり、ひとつの R^1 が4位で置換したフッ素原子また

は4位で置換した塩素原子であり、もうひとつの R^1 が6位で置換したフッ素原子または6位で置換した塩素原子であり、 R^2 がフッ素原子または塩素原子であるイミダゾピリミジン化合物；

式(1)において、 R^1 および R^2 がフッ素原子であるイミダゾピリミジン化合物
5 ；

式(1)において、 R^1 および R^2 がフッ素原子であり、 m が0～2の整数であるイミダゾピリミジン化合物；

式(1)において、 m が0であるか、 m が1であり、 R^1 が4位もしくは6位で置換したフッ素原子であるか、あるいは、 m が2であり、ひとつの R^1 が4位で置換したフッ素原子であり、もうひとつの R^1 が6位で置換したフッ素原子であり、更に
10 R^2 がフッ素原子であるイミダゾピリミジン化合物；

式(1)において、 m が1または2であり、少なくともひとつの R^1 が4位もしくは6位で置換したフッ素原子であり、 R^2 がフッ素原子であるイミダゾピリミジン化合物；

式(1)において、 m が1であり、 R^1 が6位で置換したフッ素原子であるか、あるいは、 m が2であり、ひとつの R^1 が4位で置換したフッ素原子であり、もうひとつの R^1 が6位で置換したフッ素原子であり、更に
15 R^2 がフッ素原子であるイミダゾピリミジン化合物；

式(1)において、 m が1であり、 R^1 が4位で置換したフッ素原子であり、 R^2
20 がフッ素原子であるイミダゾピリミジン化合物；

式(1)において、 m が1であり、 R^1 が6位で置換したフッ素原子であり、 R^2 がフッ素原子であるイミダゾピリミジン化合物；

式(1)において、 m が2であり、ひとつの R^1 が4位で置換したフッ素原子であり、もうひとつの R^1 が6位で置換したフッ素原子であり、 R^2 がフッ素原子であるイミダゾピリミジン化合物；
25

式(1)において、 m が1であり、 R^1 が6位で置換したフッ素原子であり、 R^2 が塩素原子であるイミダゾピリミジン化合物；

式(1)において、 R^4 がハロゲン原子またはC1-C4アルキル基であるイミダゾピリミジン化合物；

- 式(1)において、 R^4 がハロゲン原子であるイミダゾピリミジン化合物；
- 式(1)において、 R^4 が塩素原子であるイミダゾピリミジン化合物；
- 式(1)において、 R^4 がアルキル基であるイミダゾピリミジン化合物；
- 式(1)において、 R^4 がメチル基であるイミダゾピリミジン化合物；
- 5 式(1)において、 R^4 がアルコキシ基であるイミダゾピリミジン化合物；
- 式(1)において、 R^4 がメトキシ基であるイミダゾピリミジン化合物；
- 式(1)において、 R^4 がシアノ基であるイミダゾピリミジン化合物；
- 式(1)において、 R^4 が塩素原子、メチル基、メトキシ基またはシアノ基であるイミダゾピリミジン化合物；
- 10 式(1)において、 m が0～2の整数であり、 R^4 がハロゲン原子であるイミダゾピリミジン化合物；
- 式(1)において、 m が0であるか、 m が1であり、 R^1 が4位もしくは6位で置換したハロゲン原子であるか、あるいは、 m が2であり、ひとつの R^1 が4位で置換したハロゲン原子であり、もうひとつの R^1 が6位で置換したハロゲン原子であり、更に R^4 がハロゲン原子であるイミダゾピリミジン化合物；
- 15 式(1)において、 m が1または2であり、少なくともひとつの R^1 が4位もしくは6位で置換したハロゲン原子であり、 R^4 がハロゲン原子であるイミダゾピリミジン化合物；
- 式(1)において、 m が1であり、 R^1 が6位で置換したハロゲン原子であるか、あるいは、 m が2であり、ひとつの R^1 が4位で置換したハロゲン原子であり、もうひとつの R^1 が6位で置換したハロゲン原子であり、更に R^4 がハロゲン原子であるイミダゾピリミジン化合物；
- 20 式(1)において、 m が1であり、 R^1 が4位で置換したハロゲン原子であり、 R^4 がハロゲン原子であるイミダゾピリミジン化合物；
- 25 式(1)において、 m が1であり、 R^1 が6位で置換したハロゲン原子であり、 R^4 がハロゲン原子であるイミダゾピリミジン化合物；
- 式(1)において、 m が2であり、ひとつの R^1 が4位で置換したハロゲン原子であり、もうひとつの R^1 が6位で置換したハロゲン原子であり、 R^4 がハロゲン原子であるイミダゾピリミジン化合物；

式(1)において、 R^2 がフッ素原子であり、 R^4 がハロゲン原子であるイミダゾピリミジン化合物；

式(1)において、 R^2 が塩素原子であり、 R^4 がハロゲン原子であるイミダゾピリミジン化合物；

- 5 式(1)において、 m が1であり、 R^1 が6位で置換した塩素原子であり、 R^2 が塩素原子であり、 R^4 がハロゲン原子であるイミダゾピリミジン化合物；

式(1)において、 m が2であり、ひとつの R^1 が4位で置換したハロゲン原子であり、もうひとつの R^1 が6位で置換したフッ素原子であり、 R^2 がフッ素原子であり、 R^4 がハロゲン原子であるイミダゾピリミジン化合物；

- 10 式(1)において、 m が2であり、ひとつの R^1 が4位で置換したハロゲン原子であり、もうひとつの R^1 が6位で置換した塩素原子であり、 R^2 が塩素原子であり、 R^4 がハロゲン原子であるイミダゾピリミジン化合物；

式(1)において、 m が2であり、ひとつの R^1 が4位で置換したハロゲン原子であり、もうひとつの R^1 が6位で置換したフッ素原子であり、 R^2 が塩素原子であり

- 15 、 R^4 がハロゲン原子であるイミダゾピリミジン化合物；

式(1)において、 m が2であり、ひとつの R^1 が4位で置換したフッ素原子であり、もうひとつの R^1 が6位で置換したフッ素原子であり、 R^2 がフッ素原子であり、 R^4 がハロゲン原子であるイミダゾピリミジン化合物；

式(1)において、 m が2であり、ひとつの R^1 が4位で置換した塩素原子であり

- 20 、もうひとつの R^1 が6位で置換した塩素原子であり、 R^2 が塩素原子であり、 R^4 がハロゲン原子であるイミダゾピリミジン化合物；

式(1)において、 R^2 がフッ素原子または塩素原子であり、 R^4 が塩素原子であるイミダゾピリミジン化合物；

式(1)において、 R^2 がフッ素原子であり、 R^4 が塩素原子であるイミダゾピリミジン化合物；

- 25

式(1)において、 R^2 が塩素原子であり、 R^4 が塩素原子であるイミダゾピリミジン化合物；

式(1)において、 R^1 および R^2 がそれぞれ独立してフッ素原子または塩素原子であり、 R^4 が塩素原子であるイミダゾピリミジン化合物；

式(1)において、 R^1 および R^2 がそれぞれ独立してフッ素原子または塩素原子であり、 m が0~2の整数であり、 R^4 が塩素原子であるイミダゾピリミジン化合物；

- 5 式(1)において、 m が0であるか、 m が1であり、 R^1 が4位もしくは6位で置換したフッ素原子または4位もしくは6位で置換した塩素原子であるか、あるいは、 m が2であり、ひとつの R^1 が4位で置換したフッ素原子または4位で置換した塩素原子であり、もうひとつの R^1 が6位で置換したフッ素原子または6位で置換した塩素原子であり、更に R^2 がフッ素原子または塩素原子であり、 R^4 が塩素原子であるイミダゾピリミジン化合物；

- 10 式(1)において、 m が1または2であり、少なくともひとつの R^1 が4位もしくは6位で置換したフッ素原子または4位もしくは6位で置換した塩素原子であり、更に R^2 がフッ素原子もしくは塩素原子であり、 R^4 が塩素原子であるイミダゾピリミジン化合物；

- 15 式(1)において、 m が1であり、 R^1 が6位で置換したフッ素原子または6位で置換した塩素原子であるか、あるいは、 m が2であり、ひとつの R^1 が4位で置換したフッ素原子または4位で置換した塩素原子であり、もうひとつの R^1 が6位で置換したフッ素原子または6位で置換した塩素原子であり、更に R^2 がフッ素原子または塩素原子であり、 R^4 が塩素原子であるイミダゾピリミジン化合物；

- 20 式(1)において、 m が1であり、 R^1 が4位で置換したフッ素原子または4位で置換した塩素原子であり、 R^2 がフッ素原子または塩素原子であり、 R^4 が塩素原子であるイミダゾピリミジン化合物；

式(1)において、 m が1であり、 R^1 が6位で置換したフッ素原子または6位で置換した塩素原子であり、 R^2 がフッ素原子もしくは塩素原子であり、 R^4 が塩素原子であるイミダゾピリミジン化合物；

- 25 式(1)において、 m が2であり、ひとつの R^1 が4位で置換したフッ素原子または4位で置換した塩素原子であり、もうひとつの R^1 が6位で置換したフッ素原子または6位で置換した塩素原子であり、 R^2 がフッ素原子または塩素原子であり、 R^4 が塩素原子であるイミダゾピリミジン化合物；

式(1)において、 R^1 および R^2 がフッ素原子であり、 R^4 が塩素原子であるイミ

ダゾピリミジン化合物；

式(1)において、 R^1 および R^2 が塩素原子であり、 R^4 が塩素原子であるイミダゾピリミジン化合物；

式(1)において、 R^1 が塩素原子であり、 R^2 がフッ素原子であり、 R^4 が塩素原子であるイミダゾピリミジン化合物；

式(1)において、 R^1 がフッ素原子であり、 R^2 が塩素原子であり、 R^4 が塩素原子であるイミダゾピリミジン化合物；

式(1)において、 R^1 および R^2 がフッ素原子であり、 m が0～2の整数であり、 R^4 が塩素原子であるイミダゾピリミジン化合物；

式(1)において、 m が0であるか、 m が1であり、 R^1 が4位もしくは6位で置換したフッ素原子であるか、あるいは、 m が2であり、ひとつの R^1 が4位で置換したフッ素原子であり、もうひとつの R^1 が6位で置換したフッ素原子であり、更に R^2 がフッ素原子であり、 R^4 が塩素原子であるイミダゾピリミジン化合物；

式(1)において、 m が1または2であり、少なくともひとつの R^1 が4位もしくは6位で置換したフッ素原子であり、 R^2 がフッ素原子であり、 R^4 が塩素原子であるイミダゾピリミジン化合物；

式(1)において、 m が1であり、 R^1 が6位で置換したフッ素原子であるか、あるいは、 m が2であり、ひとつの R^1 が4位で置換したフッ素原子であり、もうひとつの R^1 が6位で置換したフッ素原子であり、 R^2 がフッ素原子であり、 R^4 が塩素原子であるイミダゾピリミジン化合物；

式(1)において、 m が1であり、 R^1 が4位で置換したフッ素原子であり、 R^2 がフッ素原子であり、 R^4 が塩素原子であるイミダゾピリミジン化合物；

式(1)において、 m が1であり、 R^1 が6位で置換したフッ素原子であり、 R^2 がフッ素原子であり、 R^4 が塩素原子であるイミダゾピリミジン化合物；

式(1)において、 m が2であり、ひとつの R^1 が4位で置換したフッ素原子であり、もうひとつの R^1 が6位で置換したフッ素原子であり、 R^2 がフッ素原子であり、 R^4 が塩素原子であるイミダゾピリミジン化合物；

式(1)において、 m が1であり、 R^1 が6位で置換したフッ素原子であり、 R^2 が塩素原子であり、 R^4 が塩素原子であるイミダゾピリミジン化合物；

式(1)において、 m が1であり、 R^1 が4位で置換したハロゲン原子であり、 R^4 が塩素原子であるイミダゾピリミジン化合物；

式(1)において、 m が1であり、 R^1 が6位で置換したハロゲン原子であり、 R^4 が塩素原子であるイミダゾピリミジン化合物；

- 5 式(1)において、 m が2であり、ひとつの R^1 が4位で置換したハロゲン原子であり、もうひとつの R^1 が6位で置換したハロゲン原子であり、 R^4 が塩素原子であるイミダゾピリミジン化合物；

式(1)において、 m が2であり、ひとつの R^1 が3位で置換したハロゲン原子であり、もうひとつの R^1 が6位で置換したハロゲン原子であり、 R^4 が塩素原子であ

- 10 るイミダゾピリミジン化合物；

式(1)において n が0であるイミダゾピリミジン化合物；

式(1)において n が1であるイミダゾピリミジン化合物；

式(1)において n が1であり、 R^5 の置換位置が4位であるイミダゾピリミジン化合物；

- 15 式(1)において n が1であり、 R^5 がハロゲン原子であるイミダゾピリミジン化合物；

式(1)において n が1であり、 R^5 がC1-C4アルキル基であるイミダゾピリミジン化合物；

- 20 式(1)において n が1であり、 R^5 がC1-C4ハロアルキル基であるイミダゾピリミジン化合物；

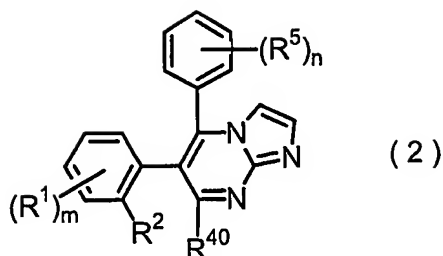
式(1)において n が1であり、 R^5 がC1-C4アルコキシ基であるイミダゾピリミジン化合物；

- 25 式(1)において n が0、1または2であり、 R^5 がハロゲン原子、C1-C4アルキル基、C1-C4ハロアルキル基、C1-C4アルコキシ基であるイミダゾピリミジン化合物；

式(1)において n が1であり、 R^5 が4位で置換した塩素原子または4位で置換したメチル基であるイミダゾピリミジン化合物。

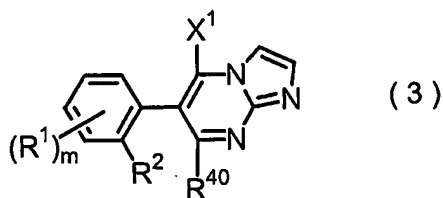
本発明化合物のうち、式(2)で示される化合物(以下、化合物(2)と記す。)

14



[式中、 R^1 、 R^2 、 R^5 、 m および n は前記と同じ意味を表し、 R^{40} はハロゲン原子またはC1-C4アルキル基を表す。]

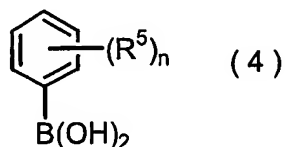
は、式(3)で示される化合物(以下、化合物(3)と記す。)



5

[式中、 R^1 、 R^2 、 R^{40} および m は前記と同じ意味を表し、 X^1 はハロゲン原子(例えば、塩素原子等)を表す。]

と式(4)で示されるフェニルボロン酸(以下、化合物(4)と記す。)



10 [式中、 R^5 および n は前記と同じ意味を表す。]

とをパラジウム触媒の存在下で反応させることにより製造することができる。

該反応は通常溶媒中、塩基の存在下で行われる。反応に用いられる溶媒としては、例えばメチル-tert-ブチルエーテル、エチレングリコールジメチルエーテル、テトラヒドロフラン、1,4-ジオキサン等のエーテル類、ヘキサン、ヘプタン、オクタン等の脂肪族炭化水素類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、アセトニトリル、ブチロニトリル等のニトリル類、水およびこれらの混合物があげられる。

15 該反応に用いられるパラジウム触媒としては例えば酢酸パラジウム、テトラキストリフェニルホスフィンパラジウム、{1,1'-ビス(ジフェニルホスフィノ)
20 }フェロセン}ジクロロパラジウム(II)塩化メチレン錯体、塩化ビス(トリ

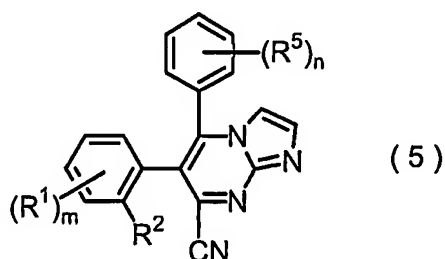
フェニルホスフィン)パラジウム、塩化{1, 4-ビス(ジフェニルホスフィノ)ブタン}パラジウムおよび塩化{1, 3-ビス(ジフェニルホスフィノ)プロパン}パラジウムがあげられ、塩基としては例えば炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、リン酸ナトリウムおよびリン酸カリウムがあげられる。

該反応において、化合物(3) 1モルに対して、化合物(4)が通常1~2モル、パラジウム触媒が通常0.001~0.1モル、塩基が通常2~20モルの割合で使用される。

該反応の反応温度は通常20~120℃の範囲であり、反応時間は通常0.1~24時間の範囲である。

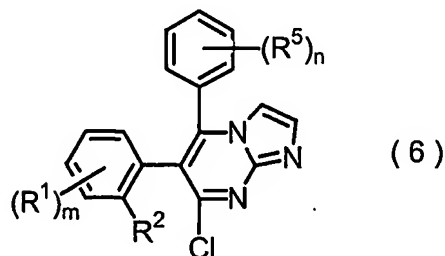
反応終了後は、例えば反応混合物を水に注加して、有機溶媒抽出し、得られた有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより式(2)で示される本発明化合物を単離することができる。単離された式(2)で示される本発明化合物はクロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

本発明化合物のうち、式(5)で示される化合物(以下、化合物(5)と記す。)



[式中、 R^1 、 R^2 、 R^5 、 m および n は前記と同じ意味を表す。]

は、式(6)で示される化合物(以下、化合物(6)と記す。)



[式中、 R^1 、 R^2 、 R^5 、 m および n は前記と同じ意味を表す。]

と金属シアン化物とを、反応させることにより製造することができる。

該反応は、溶媒の存在下で行ってもよく、用いられる溶媒としては例えばアセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、メチル-tert-ブチルエーテル、エチレングリコールジメチルエーテル、テトラヒドロフラン、1,4-ジオキサン等のエーテル類、N,N-ジメチルホルムアミド等のアミド類、ジメチルスルホキシド等のスルホキシド類があげられる。

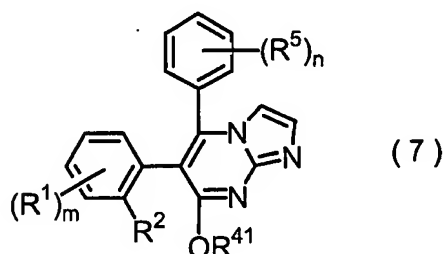
該反応に用いられる金属シアン化物としては、例えばシアン化カリウム、シアン化ナトリウム等が挙げられる。金属シアン化物は、化合物(6)1モルに対して通常1モル~10モルの割合が用いられる。

10 該反応には、必要に応じて18-クラウン-6、ジベンゾ-18-クラウン-6、ジシクロヘキサノ-18-クラウン-6、15-クラウン-5等のクラウンエーテルを共存させることもでき、その場合のクラウンエーテルは、化合物(6)1モルに対して通常1モル~10モルの割合が用いられる。

15 該反応の反応温度は通常20~150℃の範囲であり、反応時間は通常1~48時間の範囲である。

反応終了後は例えば反応混合物を水に注加して、有機溶媒抽出し、得られた有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行なうことにより、式(5)で示される本発明化合物を単離することができる。単離した式(5)で示される本発明化合物はクロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

20 本発明化合物のうち、式(7)で示される化合物(以下、化合物(7)と記す。)



[式中、 R^1 、 R^2 、 R^5 、 m および n は前記と同じ意味を表し、 R^{41} はC1-C4アルキル基を表す。]

25 は、化合物(6)と、金属アルコキシド化合物： $R^{41}OM$ [式中、 R^{41} は前記と

同じ意味を表し、Mはアルカリ金属をあらわす。]とを、反応させることにより製造することができる。

該反応は、通常溶媒中で行われる。反応に用いられる溶媒としては例えばメチル-tert-ブチルエーテル、エチレングリコールジメチルエーテル、テトラ
5 ヒドロフラン、1, 4-ジオキサン等のエーテル類、N, N-ジメチルホルムアミド等のアミド類、あるいは、用いる金属アルコキシド化合物に対応するアルコール： $R^{41}OH$ [式中、 R^{41} は前記と同じ意味を表す。] があげられる。

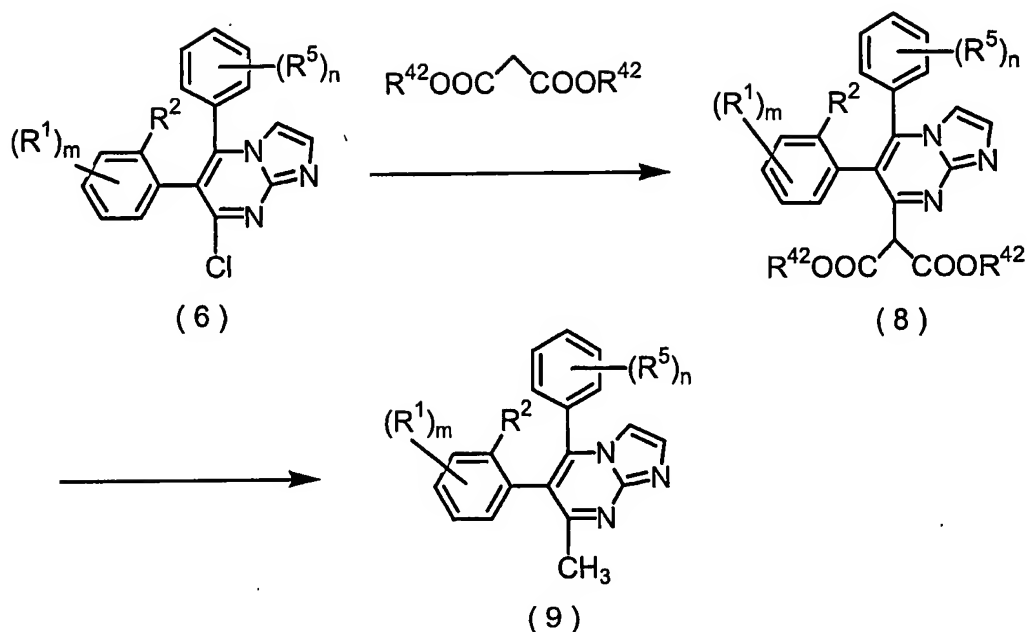
反応に用いられる金属アルコキシド化合物： $R^{41}OM$ は、アルコール： $R^{41}OH$ と、アルカリ金属（例えば、リチウム、ナトリウム、カリウム）またはアルカリ金属水素化物（例えば、水素化リチウム、水素化ナトリウム、水素化カリウム）
10 より調製することができる。通常はナトリウムアルコキシドが用いられる。金属アルコキシド化合物は、化合物（6）1モルに対して通常1モル～5モルの割合で用いられる。

該反応の反応温度は通常0～100℃の範囲であり、反応時間は通常1～48
15 時間の範囲である。

反応終了後は例えば反応混合物を水に注加して、有機溶媒抽出し、得られた有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行なうことにより、式（7）で示される本発明化合物を単離することができる。単離した式（7）で示される本発明化合物はクロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

20 本発明化合物のうち、式（9）で示される化合物（以下、化合物（9）と記す。）は、例えば以下のスキームに示されるルートで製造することができる。

18



[式中、 R^1 、 R^2 、 R^5 、 m および n は前記と同じ意味を表し、 R^{42} はC1-C4アルキル基を表す。]

工程 1-1

- 5 式(8)で示される化合物(以下、化合物(8)と記す。)は、化合物(6)とマロン酸ジアルキルとを塩基の存在下で反応させることにより製造することができる。

該反応は、通常溶媒中で行われる。反応に用いられる溶媒としては、例えばメチル-tert-ブチルエーテル、エチレングリコールジメチルエーテル、テトラヒドロフラン、1,4-ジオキサン等のエーテル類、N,N-ジメチルホルムアミド等のアミド類があげられる。反応に用いられる塩基としては、例えば水素化ナトリウム等のアルカリ金属水素化物があげられる。

該反応において、化合物(6) 1モルに対して、マロン酸ジアルキルが通常2~8モル、塩基が通常2~8モルの割合で用いられる。

- 15 該反応の反応温度は通常0~150℃の範囲であり、反応時間は通常1~48時間の範囲である。

反応終了後は例えば反応混合物を酸性水(例えば、塩酸、クエン酸水溶液等)に注加して、有機溶媒抽出し、得られた有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行なうことにより、化合物(8)を単離することができる。単離した化合物(

8) はクロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

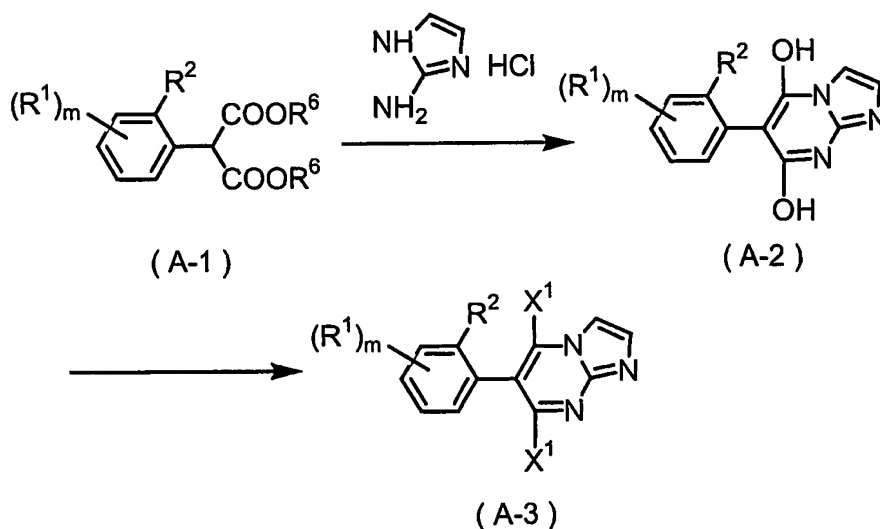
工程 1-2

化合物 (9) は、化合物 (8) を加熱分解することによって製造することができる。

- 5 該反応は、通常強酸水溶液中（塩酸、硫酸等）で行なわれ、反応温度は通常 50～100℃の範囲であり、反応時間は通常 0.1 時間～24 時間の範囲である。

反応終了後は例えば反応液を中和し、有機溶媒抽出し、得られた有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行なうことにより、化合物 (9) を単離することができる。単離した化合物 (9) はクロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

式 (A-3) で示される化合物（以下、化合物 (A-3) と記す。）は、例えば以下のスキームに示されるルートで製造することができる。



- 15 [式中、 R^1 、 R^2 、 X^1 およびmは前記と同じ意味を表し、 R^6 はC1-C4アルキル基を表す。]

工程 2-1

- 式 (A-2) で示される化合物（以下、化合物 (A-2) と記す。）は、式 (A-1) で示されるマロン酸エステル化合物（以下、化合物 (A-1) と記す。）と
20 2-アミノイミダゾール塩酸塩とを、塩基の存在下で反応させることにより製造

することができる。

該反応は、溶媒の存在下に行うこともできる。用いられる溶媒としては例えばキシレン、メシチレン等の芳香族炭化水素類およびN，N-ジメチルホルムアミド等の酸アミド類があげられる。

- 5 該反応に用いられる塩基としては例えばトリブチルアミン、1，8-ジアザビシクロ[5.4.0]ウンデック-7-エン（以下、DBUと記す。）、1，5-ジアザビシクロ[4.3.0]ノン-5-エン（以下、DBNと記す。）等の有機塩基があげられる。

- 10 該反応において、化合物（A-1）1モルに対して、2-アミノイミダゾール塩酸塩が通常0.5～2モル、塩基が通常1.5～3モルの割合で用いられる。

該反応の反応温度は通常50～200℃の範囲であり、反応時間は通常0.5～24時間の範囲である。

- 15 反応終了後は、例えば反応混合物を有機溶媒と水（またはアルカリ水）とで分液し、得られた水層（必要に応じて濃縮した後）に塩酸等の酸を加えて生じる沈殿を濾取することにより化合物（A-2）を単離することができる。また、反応混合物をそのまま又は必要に応じて濃縮した後に濾過することにより化合物（A-2）を塩の形態で単離することもできる。

工程2-1の反応は、2-アミノイミダゾール塩酸塩の代わりに2-アミノイミダゾール硫酸塩を用いても同様に行うことができる。

20 工程2-2

化合物（A-3）は化合物（A-2）とハロゲン化剤とを反応させることにより製造することができる。

- 25 該反応は溶媒の存在下に行うことができる。用いられる溶媒としては例えばトルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類および1，2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類があげられる。

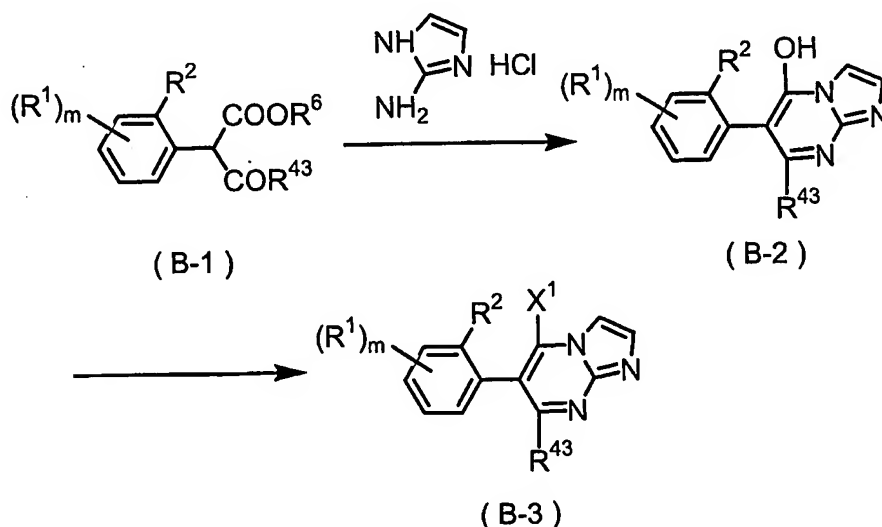
該反応に用いられるハロゲン化剤としては、例えば有機リン化合物： POX^1 ，
[式中、 X^1 は前記と同じ意味を表す。具体的には、例えばオキシ塩化リン等]があげられる。

反応に用いられるハロゲン化剤は、化合物（A-2）1モルに対して通常2モル～過剰量の割合である。

- 該反応には必要に応じてN，N-ジメチルアニリン、N，N-ジエチルアニリン、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、ピリジン、5-エチル-
 5 2-ピコリン、DBU、DBN等の有機塩基を共存させることもできる。用いられる塩基の量は、化合物（A-2）1モルに対して通常0.1～5モルの割合である。

該反応の反応温度は通常50～150℃の範囲であり、反応時間は通常1～48時間の範囲である。

- 10 反応終了後は例えば反応混合物をそのまま濃縮し、得られた残渣を有機溶媒と弱塩基水（例えば炭酸水素ナトリウム水）とで分液し、有機層を濃縮する等の後処理操作を行うことにより式（A-3）で示される化合物を単離することができる。単離した式（A-3）で示される化合物はクロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。
- 15 式（B-3）で示される化合物（以下、化合物（B-3）と記す。）は、例えば以下のスキームに示されるルートで製造することができる。



[式中、 R^1 、 R^2 、 R^6 、 X^1 および m は前記と同じ意味を表し、 R^{43} はC1-C4アルキル基を表す。]

式 (B-2) で示される化合物 (以下、化合物 (B-2) と記す。) は、式 (B-1) で示される β -ケトエステル化合物 (以下、化合物 (B-1) と記す。) と 2-アミノイミダゾール塩酸塩とを、塩基の存在下で反応させることにより製造することができる。

- 5 該反応は溶媒の存在下で行うことができる。用いられる溶媒としては例えばキシレン、メシチレン等の芳香族炭化水素類およびN, N-ジメチルホルムアミド等の酸アミド類があげられる。

該反応に用いられる塩基としては例えばトリブチルアミン、DBU、DBN等の有機塩基があげられる。

- 10 該反応においては、化合物 (B-1) 1モルに対して2-アミノイミダゾール塩酸塩が通常0.5~2モル、塩基が通常1.5~3モルの割合で用いられる。

該反応の反応温度は通常50~200℃の範囲であり、反応時間は通常0.5~24時間の範囲である。

- 15 反応終了後は、例えば反応混合物を有機溶媒と水 (またはアルカリ水) とで分液し、得られた水層 (必要に応じて濃縮した後) に塩酸等の酸を加えて生じる沈殿を濾取することにより化合物 (B-2) を単離することができる。また、反応混合物をそのまま又は必要に応じて濃縮した後に濾過することにより化合物 (B-2) で示される化合物を塩の形態で単離することもできる。

- 20 工程3-1の反応は、2-アミノイミダゾール塩酸塩の代わりに2-アミノイミダゾール硫酸塩を用いても同様に行うことができる。

工程3-2

化合物 (B-3) は、化合物 (B-2) とハロゲン化剤とを反応させることにより製造することができる。

- 25 該反応は溶媒の存在下で行うこともできる。用いられる溶媒としては例えばトルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類および1, 2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類があげられる。

該反応に用いられるハロゲン化剤としては、例えば有機リン化合物: $\text{P}(\text{O})\text{X}^1_3$ [式中、 X^1 は前記と同じ意味を表す。具体的には、例えばオキシ塩化リン等] が

あげられる。

反応に用いられるハロゲン化剤の量は式 (B-2) で示される化合物 1 モルに対して通常 1 モル～過剰量の割合である。

該反応には必要に応じて N, N-ジメチルアニリン、N, N-ジエチルアニリン、
5 トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、ピリジン、5-エチル-
2-ピコリン、DBU、DBN等の有機塩基を共存させることもでき、その場合
の塩基の量は式 (B-2) で示される化合物 1 モルに対して 0.1～5 モルの割合である。

該反応の反応温度は通常 50～150℃の範囲であり、反応時間は通常 1～4
10 8時間の範囲である。

反応終了後は例えば反応混合物をそのまま濃縮し、次いで残渣を有機溶媒と弱
塩基水（例えば炭酸水素ナトリウム水）とで分液し、得られた有機層を濃縮する
等の後処理操作を行うことにより化合物 (B-3) を単離することができる。単
離した化合物 (B-3) クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製するこ
15 ともできる。

化合物 (4) は、例えば Organic Synthesis Collective Vol. IV 68 頁に記載の方法に準じて製造することができる。

化合物 (A-1) は、例えば日本公開特許公報の特開平 2-202876 号、
Chemistry Letters, 1981, 367 頁に記載の方法に準じて製造することが
20 できる。

化合物 (B-1) は、例えば Organic Synthesis Collective Volume 2, 487-489 頁および同 284-286 頁、
日本公開特許公報の特開昭 60-255788 号等に記載の方法に準じて製造
することができる。

25 2-アミノイミダゾール硫酸塩および塩酸塩は、J. Chem. Soc., 1956, p. 307、J. Org. Chem., 1964, 3118 頁等により公知である。

次に、本発明化合物の具体例を下記に示す。

24

下記に示した式で示される化合物。

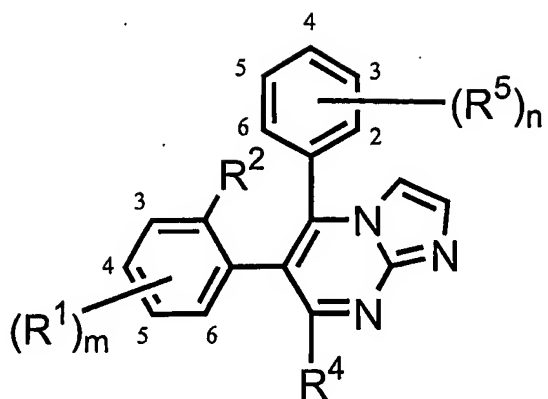


表 1

$(R^1)_m$	R^2	R^4	$(R^5)_n$
4,6-diF	F	Cl	-
4,6-diF	F	Cl	4-CH ₃
4,6-diF	F	Cl	3-CH ₃
4,6-diF	F	Cl	2-CH ₃
4,6-diF	F	Cl	4-C ₂ H ₅
4,6-diF	F	Cl	4-(CH ₂) ₂ CH ₃
4,6-diF	F	Cl	4-CH(CH ₃) ₂
4,6-diF	F	Cl	4-(CH ₂) ₃ CH ₃
4,6-diF	F	Cl	4-CH(CH ₃)C ₂ H ₅
4,6-diF	F	Cl	4-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
4,6-diF	F	Cl	4-C(CH ₃) ₃
4,6-diF	F	Cl	2,3-di(CH ₃)
4,6-diF	F	Cl	2,4-di(CH ₃)
4,6-diF	F	Cl	2,5-di(CH ₃)
4,6-diF	F	Cl	3,4-di(CH ₃)
4,6-diF	F	Cl	3,5-di(CH ₃)

(表 1 の続き)

$(R^1)_m$	R^2	R^4	$(R^5)_n$
4,6-diF	F	Cl	4-C ₆ H ₅
4,6-diF	F	Cl	3-C ₆ H ₅
4,6-diF	F	Cl	4-Cl
4,6-diF	F	Cl	3-Cl
4,6-diF	F	Cl	2-Cl
4,6-diF	F	Cl	4-F
4,6-diF	F	Cl	3-F
4,6-diF	F	Cl	2-F
4,6-diF	F	Cl	2,3-diCl
4,6-diF	F	Cl	2,4-diCl
4,6-diF	F	Cl	2,5-diCl
4,6-diF	F	Cl	3,4-diCl
4,6-diF	F	Cl	3,5-diCl
4,6-diF	F	Cl	2,3-diF
4,6-diF	F	Cl	2,4-diF
4,6-diF	F	Cl	2,5-diF
4,6-diF	F	Cl	3,4-diF
4,6-diF	F	Cl	3,5-diF
4,6-diF	F	Cl	2-Cl, 4-F
4,6-diF	F	Cl	4-CF ₃
4,6-diF	F	Cl	3-CF ₃
4,6-diF	F	Cl	2-CF ₃
4,6-diF	F	Cl	3,5-di(CF ₃)
4,6-diF	F	Cl	4-OCH ₃
4,6-diF	F	Cl	3-OCH ₃

(表 1 の続き)

$(R^1)_m$	R^2	R^4	$(R^5)_n$
4,6-diF	F	Cl	2-OCH ₃
4,6-diF	F	Cl	2,3-di(OCH ₃)
4,6-diF	F	Cl	2,4-di(OCH ₃)
4,6-diF	F	Cl	2,5-di(OCH ₃)
4,6-diF	F	Cl	3,4-di(OCH ₃)
4,6-diF	F	Cl	3,5-di(OCH ₃)
4,6-diF	F	Cl	2,3,4-tri(OCH ₃)
4,6-diF	F	Cl	3,4,5-tri(OCH ₃)
4,6-diF	F	Cl	4-OC ₂ H ₅
4,6-diF	F	Cl	3-OC ₂ H ₅
4,6-diF	F	Cl	2-OC ₂ H ₅
4,6-diF	F	Cl	4-SCH ₃
4,6-diF	F	Cl	3-SCH ₃
4,6-diF	F	Cl	2-SCH ₃
4,6-diF	F	Cl	4-SC ₂ H ₅
4,6-diF	F	Cl	4-OCF ₃
4,6-diF	F	Cl	3-OCF ₃
4,6-diF	F	Cl	2-OCF ₃
4,6-diF	F	Cl	4-CN
4,6-diF	F	Cl	3-CN
4,6-diF	F	Cl	2-CN
4,6-diF	F	Cl	4-CHO
4,6-diF	F	Cl	3-CHO
4,6-diF	F	Cl	2-CHO
4,6-diF	F	Cl	4-COCH ₃

(表 1 の続き)

$(R^1)_m$	R^2	R^4	$(R^5)_n$
4,6-diF	F	Cl	3-COCH ₃
4,6-diF	F	Cl	2-COCH ₃
4,6-diF	F	Cl	4-COOCH ₃
4,6-diF	F	Cl	4-COOC ₂ H ₅
4,6-diF	F	Cl	4-COOCH(CH ₃) ₂
4,6-diF	F	Cl	3-CH ₃ , 4-F
6-F	Cl	Cl	-
6-F	Cl	Cl	4-CH ₃
6-F	Cl	Cl	3-CH ₃
6-F	Cl	Cl	2-CH ₃
6-F	Cl	Cl	4-C ₂ H ₅
6-F	Cl	Cl	4-(CH ₂) ₂ CH ₃
6-F	Cl	Cl	4-CH(CH ₃) ₂
6-F	Cl	Cl	4-(CH ₂) ₃ CH ₃
6-F	Cl	Cl	4-CH(CH ₃)C ₂ H ₅
6-F	Cl	Cl	4-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
6-F	Cl	Cl	4-C(CH ₃) ₃
6-F	Cl	Cl	2,3-di(CH ₃)
6-F	Cl	Cl	2,4-di(CH ₃)
6-F	Cl	Cl	2,5-di(CH ₃)
6-F	Cl	Cl	3,4-di(CH ₃)
6-F	Cl	Cl	3,5-di(CH ₃)
6-F	Cl	Cl	4-C ₆ H ₅
6-F	Cl	Cl	3-C ₆ H ₅
6-F	Cl	Cl	4-Cl

(表 1 の続き)

$(R^1)_m$	R^2	R^4	$(R^5)_n$
6-F	Cl	Cl	3-Cl
6-F	Cl	Cl	2-Cl
6-F	Cl	Cl	4-F
6-F	Cl	Cl	3-F
6-F	Cl	Cl	2-F
6-F	Cl	Cl	2,3-diCl
6-F	Cl	Cl	2,4-diCl
6-F	Cl	Cl	2,5-diCl
6-F	Cl	Cl	3,4-diCl
6-F	Cl	Cl	3,5-diCl
6-F	Cl	Cl	2,3-diF
6-F	Cl	Cl	2,4-diF
6-F	Cl	Cl	2,5-diF
6-F	Cl	Cl	3,4-diF
6-F	Cl	Cl	3,5-diF
6-F	Cl	Cl	2-Cl, 4-F
6-F	Cl	Cl	4-CF ₃
6-F	Cl	Cl	3-CF ₃
6-F	Cl	Cl	2-CF ₃
6-F	Cl	Cl	3,5-di(CF ₃)
6-F	Cl	Cl	4-OCH ₃
6-F	Cl	Cl	3-OCH ₃
6-F	Cl	Cl	2-OCH ₃
6-F	Cl	Cl	2,3-di(OCH ₃)
6-F	Cl	Cl	2,4-di(OCH ₃)

(表 1 の続き)

$(R^1)_n$	R^2	R^4	$(R^5)_n$
6-F	Cl	Cl	2,5-di(OCH ₃)
6-F	Cl	Cl	3,4-di(OCH ₃)
6-F	Cl	Cl	3,5-di(OCH ₃)
6-F	Cl	Cl	2,3,4-tri(OCH ₃)
6-F	Cl	Cl	3,4,5-tri(OCH ₃)
6-F	Cl	Cl	4-OC ₂ H ₅
6-F	Cl	Cl	3-OC ₂ H ₅
6-F	Cl	Cl	2-OC ₂ H ₅
6-F	Cl	Cl	4-SCH ₃
6-F	Cl	Cl	3-SCH ₃
6-F	Cl	Cl	2-SCH ₃
6-F	Cl	Cl	4-SC ₂ H ₅
6-F	Cl	Cl	4-OCF ₃
6-F	Cl	Cl	3-OCF ₃
6-F	Cl	Cl	2-OCF ₃
6-F	Cl	Cl	4-CN
6-F	Cl	Cl	3-CN
6-F	Cl	Cl	2-CN
6-F	Cl	Cl	4-CHO
6-F	Cl	Cl	3-CHO
6-F	Cl	Cl	2-CHO
6-F	Cl	Cl	4-COCH ₃
6-F	Cl	Cl	3-COCH ₃
6-F	Cl	Cl	2-COCH ₃
6-F	Cl	Cl	4-COOCH ₃

(表 1 の続き)

$(R^1)_m$	R^2	R^4	$(R^5)_n$
6-F	Cl	Cl	4-COOC ₂ H ₅
6-F	Cl	Cl	4-COOCH(CH ₃) ₂
6-F	Cl	Cl	3-CH ₃ , 4-F
6-F	F	Cl	H
6-F	F	Cl	4-CH ₃
6-F	F	Cl	3-CH ₃
6-F	F	Cl	2-CH ₃
6-F	F	Cl	4-C ₂ H ₅
6-F	F	Cl	4-(CH ₂) ₂ CH ₃
6-F	F	Cl	4-CH(CH ₃) ₂
6-F	F	Cl	4-(CH ₂) ₃ CH ₃
6-F	F	Cl	4-CH(CH ₃)C ₂ H ₅
6-F	F	Cl	4-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
6-F	F	Cl	4-C(CH ₃) ₃
6-F	F	Cl	2,3-di(CH ₃)
6-F	F	Cl	2,4-di(CH ₃)
6-F	F	Cl	2,5-di(CH ₃)
6-F	F	Cl	3,4-di(CH ₃)
6-F	F	Cl	3,5-di(CH ₃)
6-F	F	Cl	4-C ₆ H ₅
6-F	F	Cl	3-C ₆ H ₅
6-F	F	Cl	4-Cl
6-F	F	Cl	3-Cl
6-F	F	Cl	2-Cl
6-F	F	Cl	4-F

(表 1 の続き)

$(R^1)_m$	R^2	R^4	$(R^5)_n$
6-F	F	Cl	3-F
6-F	F	Cl	2-F
6-F	F	Cl	2,3-diCl
6-F	F	Cl	2,4-diCl
6-F	F	Cl	2,5-diCl
6-F	F	Cl	3,4-diCl
6-F	F	Cl	3,5-diCl
6-F	F	Cl	2,3-diF
6-F	F	Cl	2,4-diF
6-F	F	Cl	2,5-diF
6-F	F	Cl	3,4-diF
6-F	F	Cl	3,5-diF
6-F	F	Cl	2-Cl,4-F
6-F	F	Cl	4-CF ₃
6-F	F	Cl	3-CF ₃
6-F	F	Cl	2-CF ₃
6-F	F	Cl	3,5-di(CF ₃)
6-F	F	Cl	4-OCH ₃
6-F	F	Cl	3-OCH ₃
6-F	F	Cl	2-OCH ₃
6-F	F	Cl	2,3-di(OCH ₃)
6-F	F	Cl	2,4-di(OCH ₃)
6-F	F	Cl	2,5-di(OCH ₃)
6-F	F	Cl	3,4-di(OCH ₃)
6-F	F	Cl	3,5-di(OCH ₃)

(表 1 の続き)

$(R^1)_m$	R^2	R^4	$(R^5)_n$
6-F	F	Cl	2,3,4-tri(OCH ₃)
6-F	F	Cl	3,4,5-tri(OCH ₃)
6-F	F	Cl	4-OC ₂ H ₅
6-F	F	Cl	3-OC ₂ H ₅
6-F	F	Cl	2-OC ₂ H ₅
6-F	F	Cl	4-SCH ₃
6-F	F	Cl	3-SCH ₃
6-F	F	Cl	2-SCH ₃
6-F	F	Cl	4-SC ₂ H ₅
6-F	F	Cl	4-OCF ₃
6-F	F	Cl	3-OCF ₃
6-F	F	Cl	2-OCF ₃
6-F	F	Cl	4-CN
6-F	F	Cl	3-CN
6-F	F	Cl	2-CN
6-F	F	Cl	4-CHO
6-F	F	Cl	3-CHO
6-F	F	Cl	2-CHO
6-F	F	Cl	4-COCH ₃
6-F	F	Cl	3-COCH ₃
6-F	F	Cl	2-COCH ₃
6-F	F	Cl	4-COOCH ₃
6-F	F	Cl	4-COOC ₂ H ₅
6-F	F	Cl	4-COOCH(CH ₃) ₂
6-F	F	Cl	3-CH ₃ , 4-F

(表 1 の続き)

$(R^1)_n$	R^2	R^4	$(R^5)_n$
4-F	F	Cl	-
4-F	F	Cl	4-CH ₃
4-F	F	Cl	3-CH ₃
4-F	F	Cl	2-CH ₃
4-F	F	Cl	4-C ₂ H ₅
4-F	F	Cl	4-(CH ₂) ₂ CH ₃
4-F	F	Cl	4-CH(CH ₃) ₂
4-F	F	Cl	4-(CH ₂) ₃ CH ₃
4-F	F	Cl	4-CH(CH ₃)C ₂ H ₅
4-F	F	Cl	4-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
4-F	F	Cl	4-C(CH ₃) ₃
4-F	F	Cl	2,3-di(CH ₃)
4-F	F	Cl	2,4-di(CH ₃)
4-F	F	Cl	2,5-di(CH ₃)
4-F	F	Cl	3,4-di(CH ₃)
4-F	F	Cl	3,5-di(CH ₃)
4-F	F	Cl	4-C ₆ H ₅
4-F	F	Cl	3-C ₆ H ₅
4-F	F	Cl	4-Cl
4-F	F	Cl	3-Cl
4-F	F	Cl	2-Cl
4-F	F	Cl	4-F
4-F	F	Cl	3-F

(表 1 の続き)

$(R^1)_m$	R^2	R^4	$(R^5)_n$
4-F	F	Cl	2-F
4-F	F	Cl	2,3-diCl
4-F	F	Cl	2,4-diCl
4-F	F	Cl	2,5-diCl
4-F	F	Cl	3,4-diCl
4-F	F	Cl	3,5-diCl
4-F	F	Cl	2,3-diF
4-F	F	Cl	2,4-diF
4-F	F	Cl	2,5-diF
4-F	F	Cl	3,4-diF
4-F	F	Cl	3,5-diF
4-F	F	Cl	2-Cl, 4-F
4-F	F	Cl	4-CF ₃
4-F	F	Cl	3-CF ₃
4-F	F	Cl	2-CF ₃
4-F	F	Cl	3,5-di(CF ₃)
4-F	F	Cl	4-OCH ₃
4-F	F	Cl	3-OCH ₃
4-F	F	Cl	2-OCH ₃
4-F	F	Cl	2,3-di(OCH ₃)
4-F	F	Cl	2,4-di(OCH ₃)
4-F	F	Cl	2,5-di(OCH ₃)
4-F	F	Cl	3,4-di(OCH ₃)
4-F	F	Cl	3,5-di(OCH ₃)
4-F	F	Cl	2,3,4-tri(OCH ₃)

(表 1 の続き)

$(R^1)_m$	R^2	R^4	$(R^5)_n$
4-F	F	Cl	3,4,5-tri(OCH ₃)
4-F	F	Cl	4-OC ₂ H ₅
4-F	F	Cl	3-OC ₂ H ₅
4-F	F	Cl	2-OC ₂ H ₅
4-F	F	Cl	4-SCH ₃
4-F	F	Cl	3-SCH ₃
4-F	F	Cl	2-SCH ₃
4-F	F	Cl	4-SC ₂ H ₅
4-F	F	Cl	4-OCF ₃
4-F	F	Cl	3-OCF ₃
4-F	F	Cl	2-OCF ₃
4-F	F	Cl	4-CN
4-F	F	Cl	3-CN
4-F	F	Cl	2-CN
4-F	F	Cl	4-CHO
4-F	F	Cl	3-CHO
4-F	F	Cl	2-CHO
4-F	F	Cl	4-COCH ₃
4-F	F	Cl	3-COCH ₃
4-F	F	Cl	2-COCH ₃
4-F	F	Cl	4-COOCH ₃
4-F	F	Cl	4-COOC ₂ H ₅
4-F	F	Cl	4-COOCH(CH ₃) ₂
4-F	F	Cl	3-CH ₃ , 4-F

(表 1 の続き)

$(R^1)_m$	R^2	R^4	$(R^5)_n$
6-Cl	Cl	Cl	-
6-Cl	Cl	Cl	4-CH ₃
6-Cl	Cl	Cl	3-CH ₃
6-Cl	Cl	Cl	2-CH ₃
6-Cl	Cl	Cl	4-Cl
6-Cl	Cl	Cl	3-Cl
6-Cl	Cl	Cl	2-Cl
6-Cl	Cl	Cl	4-CF ₃
6-Cl	Cl	Cl	3-CF ₃
6-Cl	Cl	Cl	2-CF ₃
6-Cl	Cl	Cl	4-OCH ₃
6-Cl	Cl	Cl	3-OCH ₃
6-Cl	Cl	Cl	2-OCH ₃
4-F, 6-Cl	Cl	Cl	-
4-F, 6-Cl	Cl	Cl	4-CH ₃
4-F, 6-Cl	Cl	Cl	3-CH ₃
4-F, 6-Cl	Cl	Cl	2-CH ₃
4-F, 6-Cl	Cl	Cl	4-Cl
4-F, 6-Cl	Cl	Cl	3-Cl
4-F, 6-Cl	Cl	Cl	2-Cl
4-F, 6-Cl	Cl	Cl	4-CF ₃
4-F, 6-Cl	Cl	Cl	3-CF ₃
4-F, 6-Cl	Cl	Cl	2-CF ₃
4-F, 6-Cl	Cl	Cl	4-OCH ₃
4-F, 6-Cl	Cl	Cl	3-OCH ₃

(表 1 の続き)

$(R^1)_n$	R^2	R^4	$(R^5)_n$
4-F,6-Cl	Cl	Cl	2-OCH ₃
4,6-diCl	Cl	Cl	-
4,6-diCl	Cl	Cl	4-CH ₃
4,6-diCl	Cl	Cl	3-CH ₃
4,6-diCl	Cl	Cl	2-CH ₃
4,6-diCl	Cl	Cl	4-Cl
4,6-diCl	Cl	Cl	3-Cl
4,6-diCl	Cl	Cl	2-Cl
4,6-diCl	Cl	Cl	4-CF ₃
4,6-diCl	Cl	Cl	3-CF ₃
4,6-diCl	Cl	Cl	2-CF ₃
4,6-diCl	Cl	Cl	4-OCH ₃
4,6-diCl	Cl	Cl	3-OCH ₃
4,6-diCl	Cl	Cl	2-OCH ₃
4-Cl	Cl	Cl	-
4-Cl	Cl	Cl	4-CH ₃
4-Cl	Cl	Cl	3-CH ₃
4-Cl	Cl	Cl	2-CH ₃
4-Cl	Cl	Cl	4-Cl
4-Cl	Cl	Cl	3-Cl
4-Cl	Cl	Cl	2-Cl
4-Cl	Cl	Cl	4-CF ₃
4-Cl	Cl	Cl	3-CF ₃
4-Cl	Cl	Cl	2-CF ₃
4-Cl	Cl	Cl	4-OCH ₃

(表 1 の続き)

$(R^1)_m$	R^2	R^4	$(R^5)_n$
4-Cl	Cl	Cl	3-OCH ₃
4-Cl	Cl	Cl	2-OCH ₃
4-F	Cl	Cl	-
4-F	Cl	Cl	4-CH ₃
4-F	Cl	Cl	3-CH ₃
4-F	Cl	Cl	2-CH ₃
4-F	Cl	Cl	4-Cl
4-F	Cl	Cl	3-Cl
4-F	Cl	Cl	2-Cl
4-F	Cl	Cl	4-CF ₃
4-F	Cl	Cl	3-CF ₃
4-F	Cl	Cl	2-CF ₃
4-F	Cl	Cl	4-OCH ₃
4-F	Cl	Cl	3-OCH ₃
4-F	Cl	Cl	2-OCH ₃
4-Cl	F	Cl	-
4-Cl	F	Cl	4-CH ₃
4-Cl	F	Cl	3-CH ₃
4-Cl	F	Cl	2-CH ₃
4-Cl	F	Cl	4-Cl
4-Cl	F	Cl	3-Cl
4-Cl	F	Cl	2-Cl
4-Cl	F	Cl	4-CF ₃
4-Cl	F	Cl	3-CF ₃
4-Cl	F	Cl	2-CF ₃

(表 1 の続き)

$(R^1)_m$	R^2	R^4	$(R^5)_n$
4-Cl	F	Cl	4-OCH ₃
4-Cl	F	Cl	3-OCH ₃
4-Cl	F	Cl	2-OCH ₃
-	Cl	Cl	-
-	Cl	Cl	4-CH ₃
-	Cl	Cl	3-CH ₃
-	Cl	Cl	2-CH ₃
-	Cl	Cl	4-Cl
-	Cl	Cl	3-Cl
-	Cl	Cl	2-Cl
-	Cl	Cl	4-CF ₃
-	Cl	Cl	3-CF ₃
-	Cl	Cl	2-CF ₃
-	Cl	Cl	4-OCH ₃
-	Cl	Cl	3-OCH ₃
-	Cl	Cl	2-OCH ₃
-	F	Cl	-
-	F	Cl	4-CH ₃
-	F	Cl	3-CH ₃
-	F	Cl	2-CH ₃
-	F	Cl	4-Cl
-	F	Cl	3-Cl
-	F	Cl	2-Cl
-	F	Cl	4-CF ₃
-	F	Cl	3-CF ₃

(表 1 の続き)

$(R^1)_m$	R^2	R^4	$(R^5)_n$
-	F	Cl	2-CF ₃
-	F	Cl	4-OCH ₃
-	F	Cl	3-OCH ₃
-	F	Cl	2-OCH ₃
3,6-diF	F	Cl	-
3,6-diF	F	Cl	4-CH ₃
3,6-diF	F	Cl	4-Cl
3,4-diF	F	Cl	-
3,4-diF	F	Cl	4-CH ₃
3,4-diF	F	Cl	4-Cl
4,5-diF	F	Cl	-
4,5-diF	F	Cl	4-CH ₃
4,5-diF	F	Cl	4-Cl
3,4,6-triF	F	Cl	-
3,4,6-triF	F	Cl	4-CH ₃
3,4,6-triF	F	Cl	4-Cl

(表 1 の続き)

$(R^1)_n$	R^2	R^4	$(R^5)_n$
6-Cl	Cl	CH ₃	-
6-Cl	Cl	CH ₃	4-CH ₃
6-Cl	Cl	CH ₃	3-CH ₃
6-Cl	Cl	CH ₃	2-CH ₃
6-Cl	Cl	CH ₃	4-Cl
6-Cl	Cl	CH ₃	3-Cl
6-Cl	Cl	CH ₃	2-Cl
6-Cl	Cl	CH ₃	4-CF ₃
6-Cl	Cl	CH ₃	3-CF ₃
6-Cl	Cl	CH ₃	2-CF ₃
6-Cl	Cl	CH ₃	4-OCH ₃
6-Cl	Cl	CH ₃	3-OCH ₃
6-Cl	Cl	CH ₃	2-OCH ₃
6-F	F	CH ₃	-
6-F	F	CH ₃	4-CH ₃
6-F	F	CH ₃	3-CH ₃
6-F	F	CH ₃	2-CH ₃
6-F	F	CH ₃	4-Cl
6-F	F	CH ₃	3-Cl
6-F	F	CH ₃	2-Cl
6-F	F	CH ₃	4-CF ₃
6-F	F	CH ₃	3-CF ₃
6-F	F	CH ₃	2-CF ₃
6-F	F	CH ₃	4-OCH ₃
6-F	F	CH ₃	3-OCH ₃

(表 1 の続き)

$(R^1)_m$	R^2	R^4	$(R^5)_n$
6-F	F	CH ₃	2-OCH ₃
6-F	Cl	CH ₃	-
6-F	Cl	CH ₃	4-CH ₃
6-F	Cl	CH ₃	3-CH ₃
6-F	Cl	CH ₃	2-CH ₃
6-F	Cl	CH ₃	4-Cl
6-F	Cl	CH ₃	3-Cl
6-F	Cl	CH ₃	2-Cl
6-F	Cl	CH ₃	4-CF ₃
6-F	Cl	CH ₃	3-CF ₃
6-F	Cl	CH ₃	2-CF ₃
6-F	Cl	CH ₃	4-OCH ₃
6-F	Cl	CH ₃	3-OCH ₃
6-F	Cl	CH ₃	2-OCH ₃
4,6-diCl	Cl	CH ₃	-
4,6-diCl	Cl	CH ₃	4-CH ₃
4,6-diCl	Cl	CH ₃	3-CH ₃
4,6-diCl	Cl	CH ₃	2-CH ₃
4,6-diCl	Cl	CH ₃	4-Cl
4,6-diCl	Cl	CH ₃	3-Cl
4,6-diCl	Cl	CH ₃	2-Cl
4,6-diCl	Cl	CH ₃	4-CF ₃
4,6-diCl	Cl	CH ₃	3-CF ₃
4,6-diCl	Cl	CH ₃	2-CF ₃
4,6-diCl	Cl	CH ₃	4-OCH ₃

(表 1 の続き)

$(R^1)_m$	R^2	R^4	$(R^5)_n$
4,6-diCl	Cl	CH ₃	3-OCH ₃
4,6-diCl	Cl	CH ₃	2-OCH ₃
4,6-diF	F	CH ₃	-
4,6-diF	F	CH ₃	4-CH ₃
4,6-diF	F	CH ₃	3-CH ₃
4,6-diF	F	CH ₃	2-CH ₃
4,6-diF	F	CH ₃	4-Cl
4,6-diF	F	CH ₃	3-Cl
4,6-diF	F	CH ₃	2-Cl
4,6-diF	F	CH ₃	4-CF ₃
4,6-diF	F	CH ₃	3-CF ₃
4,6-diF	F	CH ₃	2-CF ₃
4,6-diF	F	CH ₃	4-OCH ₃
4,6-diF	F	CH ₃	3-OCH ₃
4,6-diF	F	CH ₃	2-OCH ₃
4-F	F	CH ₃	-
4-F	F	CH ₃	4-CH ₃
4-F	F	CH ₃	3-CH ₃
4-F	F	CH ₃	2-CH ₃
4-F	F	CH ₃	4-Cl
4-F	F	CH ₃	3-Cl
4-F	F	CH ₃	2-Cl
4-F	F	CH ₃	4-CF ₃
4-F	F	CH ₃	3-CF ₃
4-F	F	CH ₃	2-CF ₃

(表 1 の続き)

$(R^1)_m$	R^2	R^4	$(R^5)_n$
4-F	F	CH ₃	4-OCH ₃
4-F	F	CH ₃	3-OCH ₃
4-F	F	CH ₃	2-OCH ₃
4-Cl	Cl	CH ₃	-
4-Cl	Cl	CH ₃	4-CH ₃
4-Cl	Cl	CH ₃	3-CH ₃
4-Cl	Cl	CH ₃	2-CH ₃
4-Cl	Cl	CH ₃	4-Cl
4-Cl	Cl	CH ₃	3-Cl
4-Cl	Cl	CH ₃	2-Cl
4-Cl	Cl	CH ₃	4-CF ₃
4-Cl	Cl	CH ₃	3-CF ₃
4-Cl	Cl	CH ₃	2-CF ₃
4-Cl	Cl	CH ₃	4-OCH ₃
4-Cl	Cl	CH ₃	3-OCH ₃
4-Cl	Cl	CH ₃	2-OCH ₃
-	F	CH ₃	-
-	F	CH ₃	4-CH ₃
-	F	CH ₃	3-CH ₃
-	F	CH ₃	2-CH ₃
-	F	CH ₃	4-Cl
-	F	CH ₃	3-Cl
-	F	CH ₃	2-Cl
-	F	CH ₃	4-CF ₃
-	F	CH ₃	3-CF ₃

(表 1 の続き)

$(R^1)_m$	R^2	R^4	$(R^5)_n$
-	F	CH ₃	2-CF ₃
-	F	CH ₃	4-OCH ₃
-	F	CH ₃	3-OCH ₃
-	F	CH ₃	2-OCH ₃
-	Cl	CH ₃	-
-	Cl	CH ₃	4-CH ₃
-	Cl	CH ₃	3-CH ₃
-	Cl	CH ₃	2-CH ₃
-	Cl	CH ₃	4-Cl
-	Cl	CH ₃	3-Cl
-	Cl	CH ₃	2-Cl
-	Cl	CH ₃	4-CF ₃
-	Cl	CH ₃	3-CF ₃
-	Cl	CH ₃	2-CF ₃
-	Cl	CH ₃	4-OCH ₃
-	Cl	CH ₃	3-OCH ₃
-	Cl	CH ₃	2-OCH ₃
6-Cl	Cl	OCH ₃	-
6-Cl	Cl	OCH ₃	4-CH ₃
6-Cl	Cl	OCH ₃	3-CH ₃
6-Cl	Cl	OCH ₃	2-CH ₃
6-Cl	Cl	OCH ₃	4-Cl
6-Cl	Cl	OCH ₃	3-Cl
6-Cl	Cl	OCH ₃	2-Cl
6-Cl	Cl	OCH ₃	4-CF ₃

(表 1 の続き)

$(R^1)_m$	R^2	R^4	$(R^5)_n$
6-Cl	Cl	OCH ₃	3-CF ₃
6-Cl	Cl	OCH ₃	2-CF ₃
6-Cl	Cl	OCH ₃	4-OCH ₃
6-Cl	Cl	OCH ₃	3-OCH ₃
6-Cl	Cl	OCH ₃	2-OCH ₃
6-F	F	OCH ₃	-
6-F	F	OCH ₃	4-CH ₃
6-F	F	OCH ₃	3-CH ₃
6-F	F	OCH ₃	2-CH ₃
6-F	F	OCH ₃	4-Cl
6-F	F	OCH ₃	3-Cl
6-F	F	OCH ₃	2-Cl
6-F	F	OCH ₃	4-CF ₃
6-F	F	OCH ₃	3-CF ₃
6-F	F	OCH ₃	2-CF ₃
6-F	F	OCH ₃	4-OCH ₃
6-F	F	OCH ₃	3-OCH ₃
6-F	F	OCH ₃	2-OCH ₃
6-F	Cl	OCH ₃	-
6-F	Cl	OCH ₃	4-CH ₃
6-F	Cl	OCH ₃	3-CH ₃
6-F	Cl	OCH ₃	2-CH ₃
6-F	Cl	OCH ₃	4-Cl
6-F	Cl	OCH ₃	3-Cl
6-F	Cl	OCH ₃	2-Cl

(表 1 の続き)

$(R^1)_m$	R^2	R^4	$(R^5)_n$
6-F	Cl	OCH ₃	4-CF ₃
6-F	Cl	OCH ₃	3-CF ₃
6-F	Cl	OCH ₃	2-CF ₃
6-F	Cl	OCH ₃	4-OCH ₃
6-F	Cl	OCH ₃	3-OCH ₃
6-F	Cl	OCH ₃	2-OCH ₃
4,6-diCl	Cl	OCH ₃	-
4,6-diCl	Cl	OCH ₃	4-CH ₃
4,6-diCl	Cl	OCH ₃	3-CH ₃
4,6-diCl	Cl	OCH ₃	2-CH ₃
4,6-diCl	Cl	OCH ₃	4-Cl
4,6-diCl	Cl	OCH ₃	3-Cl
4,6-diCl	Cl	OCH ₃	2-Cl
4,6-diCl	Cl	OCH ₃	4-CF ₃
4,6-diCl	Cl	OCH ₃	3-CF ₃
4,6-diCl	Cl	OCH ₃	2-CF ₃
4,6-diCl	Cl	OCH ₃	4-OCH ₃
4,6-diCl	Cl	OCH ₃	3-OCH ₃
4,6-diCl	Cl	OCH ₃	2-OCH ₃
4,6-diF	F	OCH ₃	-
4,6-diF	F	OCH ₃	4-CH ₃
4,6-diF	F	OCH ₃	3-CH ₃
4,6-diF	F	OCH ₃	2-CH ₃
4,6-diF	F	OCH ₃	4-Cl
4,6-diF	F	OCH ₃	3-Cl

(表 1 の続き)

$(R^1)_m$	R^2	R^4	$(R^5)_n$
4,6-diF	F	OCH ₃	2-Cl
4,6-diF	F	OCH ₃	4-CF ₃
4,6-diF	F	OCH ₃	3-CF ₃
4,6-diF	F	OCH ₃	2-CF ₃
4,6-diF	F	OCH ₃	4-OCH ₃
4,6-diF	F	OCH ₃	3-OCH ₃
4,6-diF	F	OCH ₃	2-OCH ₃
4-F	F	OCH ₃	-
4-F	F	OCH ₃	4-CH ₃
4-F	F	OCH ₃	3-CH ₃
4-F	F	OCH ₃	2-CH ₃
4-F	F	OCH ₃	4-Cl
4-F	F	OCH ₃	3-Cl
4-F	F	OCH ₃	2-Cl
4-F	F	OCH ₃	4-CF ₃
4-F	F	OCH ₃	3-CF ₃
4-F	F	OCH ₃	2-CF ₃
4-F	F	OCH ₃	4-OCH ₃
4-F	F	OCH ₃	3-OCH ₃
4-F	F	OCH ₃	2-OCH ₃
4-Cl	Cl	OCH ₃	-
4-Cl	Cl	OCH ₃	4-CH ₃
4-Cl	Cl	OCH ₃	3-CH ₃
4-Cl	Cl	OCH ₃	2-CH ₃
4-Cl	Cl	OCH ₃	4-Cl

(表 1 の続き)

$(R^1)_m$	R^2	R^4	$(R^5)_n$
4-Cl	Cl	OCH ₃	3-Cl
4-Cl	Cl	OCH ₃	2-Cl
4-Cl	Cl	OCH ₃	4-CF ₃
4-Cl	Cl	OCH ₃	3-CF ₃
4-Cl	Cl	OCH ₃	2-CF ₃
4-Cl	Cl	OCH ₃	4-OCH ₃
4-Cl	Cl	OCH ₃	3-OCH ₃
4-Cl	Cl	OCH ₃	2-OCH ₃
-	F	OCH ₃	-
-	F	OCH ₃	4-CH ₃
-	F	OCH ₃	3-CH ₃
-	F	OCH ₃	2-CH ₃
-	F	OCH ₃	4-Cl
-	F	OCH ₃	3-Cl
-	F	OCH ₃	2-Cl
-	F	OCH ₃	4-CF ₃
-	F	OCH ₃	3-CF ₃
-	F	OCH ₃	2-CF ₃
-	F	OCH ₃	4-OCH ₃
-	F	OCH ₃	3-OCH ₃
-	F	OCH ₃	2-OCH ₃
-	Cl	OCH ₃	-
-	Cl	OCH ₃	4-CH ₃
-	Cl	OCH ₃	3-CH ₃
-	Cl	OCH ₃	2-CH ₃

(表 1 の続き)

$(R^1)_m$	R^2	R^4	$(R^5)_n$
-	Cl	OCH ₃	4-Cl
-	Cl	OCH ₃	3-Cl
-	Cl	OCH ₃	2-Cl
-	Cl	OCH ₃	4-CF ₃
-	Cl	OCH ₃	3-CF ₃
-	Cl	OCH ₃	2-CF ₃
-	Cl	OCH ₃	4-OCH ₃
-	Cl	OCH ₃	3-OCH ₃
-	Cl	OCH ₃	2-OCH ₃
6-Cl	Cl	CN	-
6-Cl	Cl	CN	4-CH ₃
6-Cl	Cl	CN	3-CH ₃
6-Cl	Cl	CN	2-CH ₃
6-Cl	Cl	CN	4-Cl
6-Cl	Cl	CN	3-Cl
6-Cl	Cl	CN	2-Cl
6-Cl	Cl	CN	4-CF ₃
6-Cl	Cl	CN	3-CF ₃
6-Cl	Cl	CN	2-CF ₃
6-Cl	Cl	CN	4-OCH ₃
6-Cl	Cl	CN	3-OCH ₃
6-Cl	Cl	CN	2-OCH ₃
6-F	F	CN	H
6-F	F	CN	4-CH ₃
6-F	F	CN	3-CH ₃

(表 1 の続き)

$(R^1)_m$	R^2	R^4	$(R^5)_n$
6-F	F	CN	2-CH ₃
6-F	F	CN	4-Cl
6-F	F	CN	3-Cl
6-F	F	CN	2-Cl
6-F	F	CN	4-CF ₃
6-F	F	CN	3-CF ₃
6-F	F	CN	2-CF ₃
6-F	F	CN	4-OCH ₃
6-F	F	CN	3-OCH ₃
6-F	F	CN	2-OCH ₃
6-F	Cl	CN	-
6-F	Cl	CN	4-CH ₃
6-F	Cl	CN	3-CH ₃
6-F	Cl	CN	2-CH ₃
6-F	Cl	CN	4-Cl
6-F	Cl	CN	3-Cl
6-F	Cl	CN	2-Cl
6-F	Cl	CN	4-CF ₃
6-F	Cl	CN	3-CF ₃
6-F	Cl	CN	2-CF ₃
6-F	Cl	CN	4-OCH ₃
6-F	Cl	CN	3-OCH ₃
6-F	Cl	CN	2-OCH ₃
4,6-diCl	Cl	CN	-
4,6-diCl	Cl	CN	4-CH ₃

(表 1 の続き 9)

$(R^1)_m$	R^2	R^4	$(R^5)_n$
4,6-diCl	Cl	CN	3-CH ₃
4,6-diCl	Cl	CN	2-CH ₃
4,6-diCl	Cl	CN	4-Cl
4,6-diCl	Cl	CN	3-Cl
4,6-diCl	Cl	CN	2-Cl
4,6-diCl	Cl	CN	4-CF ₃
4,6-diCl	Cl	CN	3-CF ₃
4,6-diCl	Cl	CN	2-CF ₃
4,6-diCl	Cl	CN	4-OCH ₃
4,6-diCl	Cl	CN	3-OCH ₃
4,6-diCl	Cl	CN	2-OCH ₃
4,6-diF	F	CN	-
4,6-diF	F	CN	4-CH ₃
4,6-diF	F	CN	3-CH ₃
4,6-diF	F	CN	2-CH ₃
4,6-diF	F	CN	4-Cl
4,6-diF	F	CN	3-Cl
4,6-diF	F	CN	2-Cl
4,6-diF	F	CN	4-CF ₃
4,6-diF	F	CN	3-CF ₃
4,6-diF	F	CN	2-CF ₃
4,6-diF	F	CN	4-OCH ₃
4,6-diF	F	CN	3-OCH ₃
4,6-diF	F	CN	2-OCH ₃

(表 1 の続き)

$(R^1)_n$	R^2	R^4	$(R^5)_n$
4-F	F	CN	-
4-F	F	CN	4-CH ₃
4-F	F	CN	3-CH ₃
4-F	F	CN	2-CH ₃
4-F	F	CN	4-Cl
4-F	F	CN	3-Cl
4-F	F	CN	2-Cl
4-F	F	CN	4-CF ₃
4-F	F	CN	3-CF ₃
4-F	F	CN	2-CF ₃
4-F	F	CN	4-OCH ₃
4-F	F	CN	3-OCH ₃
4-F	F	CN	2-OCH ₃
4-Cl	Cl	CN	-
4-Cl	Cl	CN	4-CH ₃
4-Cl	Cl	CN	3-CH ₃
4-Cl	Cl	CN	2-CH ₃
4-Cl	Cl	CN	4-Cl
4-Cl	Cl	CN	3-Cl
4-Cl	Cl	CN	2-Cl
4-Cl	Cl	CN	4-CF ₃
4-Cl	Cl	CN	3-CF ₃
4-Cl	Cl	CN	2-CF ₃
4-Cl	Cl	CN	4-OCH ₃

(表 1 の続き)

$(R^1)_m$	R^2	R^4	$(R^5)_n$
4-Cl	Cl	CN	3-OCH ₃
4-Cl	Cl	CN	2-OCH ₃
-	F	CN	-
-	F	CN	4-CH ₃
-	F	CN	3-CH ₃
-	F	CN	2-CH ₃
-	F	CN	4-Cl
-	F	CN	3-Cl
-	F	CN	2-Cl
-	F	CN	4-CF ₃
-	F	CN	3-CF ₃
-	F	CN	2-CF ₃
-	F	CN	4-OCH ₃
-	F	CN	3-OCH ₃
-	F	CN	2-OCH ₃
-	Cl	CN	-
-	Cl	CN	4-CH ₃
-	Cl	CN	3-CH ₃
-	Cl	CN	2-CH ₃
-	Cl	CN	4-Cl
-	Cl	CN	3-Cl
-	Cl	CN	2-Cl
-	Cl	CN	4-CF ₃
-	Cl	CN	3-CF ₃

(表 1 の続き)

$(R^1)_m$	R^2	R^4	$(R^5)_n$
-	Cl	CN	2-CF ₃
-	Cl	CN	4-OCH ₃
-	Cl	CN	3-OCH ₃
-	Cl	CN	2-OCH ₃
4,6-diF	F	C ₂ H ₅	-
4,6-diF	F	C ₂ H ₅	4-CH ₃
4,6-diF	F	C ₂ H ₅	4-Cl
4,6-diF	F	(CH ₂) ₂ CH ₃	-
4,6-diF	F	(CH ₂) ₂ CH ₃	4-CH ₃
4,6-diF	F	(CH ₂) ₂ CH ₃	4-Cl
4,6-diF	F	CH(CH ₃) ₂	-
4,6-diF	F	CH(CH ₃) ₂	4-CH ₃
4,6-diF	F	CH(CH ₃) ₂	4-Cl
4,6-diF	F	OC ₂ H ₅	-
4,6-diF	F	OC ₂ H ₅	4-CH ₃
4,6-diF	F	OC ₂ H ₅	4-Cl
4,6-diF	F	O(CH ₂) ₂ CH ₃	-
4,6-diF	F	O(CH ₂) ₂ CH ₃	4-CH ₃
4,6-diF	F	O(CH ₂) ₂ CH ₃	4-Cl
4,6-diF	F	OCH(CH ₃) ₂	-
4,6-diF	F	OCH(CH ₃) ₂	4-CH ₃
4,6-diF	F	OCH(CH ₃) ₂	4-Cl

(表 1 の続き)

$(R^1)_n$	R^2	R^4	$(R^5)_n$
6-F	Cl	C_2H_5	-
6-F	Cl	C_2H_5	4- CH_3
6-F	Cl	C_2H_5	4-Cl
6-F	Cl	$(CH_2)_2CH_3$	-
6-F	Cl	$(CH_2)_2CH_3$	4- CH_3
6-F	Cl	$(CH_2)_2CH_3$	4-Cl
6-F	Cl	$CH(CH_3)_2$	-
6-F	Cl	$CH(CH_3)_2$	4- CH_3
6-F	Cl	$CH(CH_3)_2$	4-Cl
6-F	Cl	OC_2H_5	-
6-F	Cl	OC_2H_5	4- CH_3
6-F	Cl	OC_2H_5	4-Cl
6-F	Cl	$O(CH_2)_2CH_3$	-
6-F	Cl	$O(CH_2)_2CH_3$	4- CH_3
6-F	Cl	$O(CH_2)_2CH_3$	4-Cl
6-F	Cl	$OCH(CH_3)_2$	-
6-F	Cl	$OCH(CH_3)_2$	4- CH_3
6-F	Cl	$OCH(CH_3)_2$	4-Cl

(表 1 の続き)

$(R^1)_m$	R^2	R^4	$(R^5)_n$
6-F	F	C_2H_5	-
6-F	F	C_2H_5	4- CH_3
6-F	F	C_2H_5	4-Cl
6-F	F	$(CH_2)_2CH_3$	-
6-F	F	$(CH_2)_2CH_3$	4- CH_3
6-F	F	$(CH_2)_2CH_3$	4-Cl
6-F	F	$CH(CH_3)_2$	-
6-F	F	$CH(CH_3)_2$	4- CH_3
6-F	F	$CH(CH_3)_2$	4-Cl
6-F	F	OC_2H_5	-
6-F	F	OC_2H_5	4- CH_3
6-F	F	OC_2H_5	4-Cl
6-F	F	$O(CH_2)_2CH_3$	-
6-F	F	$O(CH_2)_2CH_3$	4- CH_3
6-F	F	$O(CH_2)_2CH_3$	4-Cl
6-F	F	$OCH(CH_3)_2$	-
6-F	F	$OCH(CH_3)_2$	4- CH_3
6-F	F	$OCH(CH_3)_2$	4-Cl
4-F	F	C_2H_5	-
4-F	F	C_2H_5	4- CH_3
4-F	F	C_2H_5	4-Cl
4-F	F	$(CH_2)_2CH_3$	-
4-F	F	$(CH_2)_2CH_3$	4- CH_3
4-F	F	$(CH_2)_2CH_3$	4-Cl

(表 1 の続き)

$(R^1)_m$	R^2	R^4	$(R^5)_n$
4-F	F	$CH(CH_3)_2$	-
4-F	F	$CH(CH_3)_2$	4-CH ₃
4-F	F	$CH(CH_3)_2$	4-Cl
4-F	F	OC_2H_5	-
4-F	F	OC_2H_5	4-CH ₃
4-F	F	OC_2H_5	4-Cl
4-F	F	$O(CH_2)_2CH_3$	-
4-F	F	$O(CH_2)_2CH_3$	4-CH ₃
4-F	F	$O(CH_2)_2CH_3$	4-Cl
4-F	F	$OCH(CH_3)_2$	-
4-F	F	$OCH(CH_3)_2$	4-CH ₃
4-F	F	$OCH(CH_3)_2$	4-Cl
3,6-diF	F	CH ₃	-
3,6-diF	F	CH ₃	4-CH ₃
3,6-diF	F	CH ₃	4-Cl
3,4-diF	F	CH ₃	-
3,4-diF	F	CH ₃	4-CH ₃
3,4-diF	F	CH ₃	4-Cl
4,5-diF	F	CH ₃	-
4,5-diF	F	CH ₃	4-CH ₃
4,5-diF	F	CH ₃	4-Cl
3,4,6-triF	F	CH ₃	-
3,4,6-triF	F	CH ₃	4-CH ₃
3,4,6-triF	F	CH ₃	4-Cl

(表 1 の続き)

$(R^1)_n$	R^2	R^4	$(R^5)_n$
3,6-diF	F	OCH ₃	-
3,6-diF	F	OCH ₃	4-CH ₃
3,6-diF	F	OCH ₃	4-Cl
3,4-diF	F	OCH ₃	-
3,4-diF	F	OCH ₃	4-CH ₃
3,4-diF	F	OCH ₃	4-Cl
4,5-diF	F	OCH ₃	-
4,5-diF	F	OCH ₃	4-CH ₃
4,5-diF	F	OCH ₃	4-Cl
3,4,6-triF	F	OCH ₃	-
3,4,6-triF	F	OCH ₃	4-CH ₃
3,4,6-triF	F	OCH ₃	4-Cl
3,6-diF	F	CN	-
3,6-diF	F	CN	4-CH ₃
3,6-diF	F	CN	4-Cl
3,4-diF	F	CN	-
3,4-diF	F	CN	4-CH ₃
3,4-diF	F	CN	4-Cl
4,5-diF	F	CN	-
4,5-diF	F	CN	4-CH ₃
4,5-diF	F	CN	4-Cl
3,4,6-triF	F	CN	-
3,4,6-triF	F	CN	4-CH ₃
3,4,6-triF	F	CN	4-Cl

本発明化合物が防除効力を有する植物病害としては例えば次のものがあげられる。

イネのいもち病 (*Pyricularia oryzae*)、ごま葉枯病 (*Cochliobolus miyabeanus*)、紋枯病 (*Rhizoctonia solani*) ;

- 5 ムギ類のうどんこ病 (*Erysiphe graminis*)、赤かび病 (*Gibberella zeae*)、
さび病 (*Puccinia striiformis*, *P. graminis*, *P. recondita*, *P. hordei*)、雪
腐病 (*Typhula* sp., *Micronectriella nivalis*)、裸黒穂病 (*Ustilago tritici*, *U.*
nuda)、なまぐさ黒穂病 (*Tilletia caries*)、眼紋病 (*Pseudocercospora*
herpotrichoides)、雲形病 (*Rhynchosporium secalis*)、葉枯病 (*Septoria tritici*)、
10 ふ枯病 (*Leptosphaeria nodorum*) ;

カンキツ類の黒点病 (*Diaporthe citri*)、そうか病 (*Elsinoe fawcetti*)、
果実腐敗病 (*Penicillium digitatum*, *P. italicum*) ;

- リンゴのモニリア病 (*Sclerotinia mali*)、腐らん病 (*Valsa mali*)、うどん
こ病 (*Podosphaera leucotricha*)、斑点落葉病 (*Alternaria mali*)、黒星病
15 (*Venturia inaequalis*) ;

 ナシの黒星病 (*Venturia nashicola*, *V. pirina*)、黒斑病 (*Alternaria*
kikuchiana)、赤星病 (*Gymnosporangium haraeaeum*) ;

 モモの灰星病 (*Sclerotinia cinerea*)、黒星病 (*Cladosporium carpophilum*)、
フォモプシス腐敗病 (*Phomopsis* sp.) ;

- 20 ブドウの黒とう病 (*Elsinoe ampelina*)、晩腐病 (*Glomerella cingulata*)、
うどんこ病 (*Uncinula necator*)、さび病 (*Phakopsora ampelopsidis*)、ブラック
ロット病 (*Guignardia bidwellii*)、べと病 (*Plasmopara viticola*) ;

 カキの炭そ病 (*Gloeosporium kaki*)、落葉病 (*Cercospora kaki*,
Mycosphaerella nawae) ;

- 25 ウリ類の炭そ病 (*Colletotrichum lagenarium*)、うどんこ病
(*Sphaerotheca fuliginea*)、つる枯病 (*Mycosphaerella melonis*)、つる割病
(*Fusarium oxysporum*)、べと病 (*Pseudoperonospora cubensis*)、疫病
(*Phytophthora* sp.)、苗立枯病 (*Pythium* sp.) ;

 トマトの輪紋病 (*Alternaria solani*)、葉かび病 (*Cladosporium fulvum*)、

疫病 (*Phytophthora infestans*) ;

ナスの褐紋病 (*Phomopsis vexans*)、うどんこ病 (*Erysiphe cichoracearum*) ;

アブラナ科野菜の黒斑病 (*Alternaria japonica*)、白斑病 (*Cercospora brassicae*) ;

- 5 ネギのさび病 (*Puccinia allii*)、ダイズの紫斑病 (*Cercospora kikuchii*)、
黒とう病 (*Elsinoe glycines*)、黒点病 (*Diaporthe phaseolorum* var. *sojae*) ;

インゲンの炭そ病 (*Colletotrichum lindemthianum*) ;

ラッカセイの黒渋病 (*Cercospora personata*)、褐斑病 (*Cercospora arachidicola*) ;

- 10 エンドウのうどんこ病 (*Erysiphe pisi*) ;

ジャガイモの夏疫病 (*Alternaria solani*)、疫病 (*Phytophthora infestans*) ;

イチゴのうどんこ病 (*Sphaerotheca humuli*) ;

茶の網もち病 (*Exobasidium reticulatum*) ; 白星病 (*Elsinoe leucospila*)、

- 15 タバコの赤星病 (*Alternaria longipes*)、うどんこ病 (*Erysiphe cichoracearum*)、炭そ病 (*Colletotrichum tabacum*)、べと病 (*Peronospora tabacina*)、疫病 (*Phytophthora nicotianae*) ;

テンサイの褐斑病 (*Cercospora beticola*) ;

バラの黒星病 (*Diplocarpon rosae*)、うどんこ病 (*Sphaerotheca pannosa*) ;

- 20 キクの褐斑病 (*Septoria chrysanthemi-indici*)、白さび病 (*Puccinia horiana*) ;

種々の作物の灰色かび病 (*Botrytis cinerea*)、菌核病 (*Sclerotinia sclerotiorum*)。

- 本発明化合物は、そのものを植物または土壤に施用することによっても、殺菌
25 効力を発揮するが、通常は本発明化合物と適当な担体を含有する殺菌組成物の形態にて用いられる。本発明の殺菌組成物は通常、本発明化合物と固体担体および／または液体担体とを混合し、必要に応じて界面活性剤その他の製剤用補助剤を添加して、乳剤、水和剤、顆粒水和剤、フロアブル剤、粉剤、粒剤等の製剤として、調製される。

これらの製剤にて、本発明化合物は通常0.1～90重量%含有される。

- 製剤化の際に用いられる固体担体としては、例えばカオリンクレー、アッタパールジャイトクレー、ペントナイト、モンモリロナイト、酸性白土、パイロフィライト、タルク、珪藻土、方解石等の鉱物、トウモロコシ穂軸粉、クルミ殻粉等の天然有機物、尿素等の合成有機物、炭酸カルシウム、硫酸アンモニウム等の塩類、5 合成含水酸化珪素等の合成無機物等からなる微粉末あるいは粒状物等が挙げられ、液体担体としては、例えばキシレン、アルキルベンゼン、メチルナフタレン等の芳香族炭化水素類、2-プロパノール、エチレングリコール、プロピレングリコール、セロソルブ等のアルコール類、アセトン、シクロヘキサノン、イソホロン10 等のケトン類、ダイズ油、綿実油等の植物油、石油系脂肪族炭化水素類、エステル類、ジメチルスルホキシド、アセトニトリルおよび水が挙げられる。

- 界面活性剤としては、例えばアルキル硫酸エステル塩、アルキルアリールスルホン酸塩、ジアルキルスルホコハク酸塩、ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテルリン酸エステル塩、リグニンスルホン酸塩、ナフタレンスルホネートホルモアルデヒド重縮合物等の陰イオン界面活性剤およびポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル、ポリオキシエチレンアルキルポリオキシプロピレンブ15 ックコポリマー、ソルビタン脂肪酸エステル等の非イオン界面活性剤が挙げられる。

- その他の製剤用補助剤としては、例えばポリビニルアルコール、ポリビニルピロリドン等の水溶性高分子、アラビアガム、アルギン酸およびその塩、CMC（カルボキシメチルセルロース）、ザンサンガム等の多糖類、アルミニウムマグネシウムシリケート、アルミナゾル等の無機物、防腐剤、着色剤およびPAP（酸性リン酸イソプロピル）、BHT等の安定化剤が挙げられる。20

- 25 本発明の菌組成物を植物体に処理することにより、該植物を植物病害から保護する、即ち植物病害を防除することができる。また、本発明の殺菌組成物を土壤に処理することにより、該土壤に生育する植物を植物病害から保護する、即ち植物病害を防除することができる。

本発明の殺菌組成物を植物体に茎葉処理する場合、又は本発明の殺菌組成物を

土壤に処理する場合、その処理量は、防除対象植物である作物等の種類、防除対象病害の種類、防除対象病害の発生程度、製剤形態、処理時期、気象条件等によって変化させ得るが、 10000 m^2 あたり本発明化合物として通常 $1\sim5000\text{ g}$ 、好ましくは $5\sim1000\text{ g}$ である。

- 5 乳剤、水和剤、フロアブル剤等は通常を水で希釈して散布することにより処理する。この場合、本発明化合物の濃度は通常 $0.0001\sim3$ 重量%、好ましくは $0.0005\sim1$ 重量%の範囲である。粉剤、粒剤等は通常希釈することなくそのまま処理する。

- また、本発明の殺菌組成物を植物体に処理する場合、該植物の種子の時期に処理することにより、該植物を植物病害から保護することができる。その具体的な方法としては、例えば植物の種子を本発明化合物の濃度が $1\sim1000\text{ ppm}$ に調製した本発明の殺菌組成物に種子を浸漬する方法、植物の種子に本発明化合物の濃度が $1\sim1000\text{ ppm}$ の本発明の殺菌組成物を噴霧もしくは塗抹する方法、および植物の種子に本発明の殺菌組成物を粉衣する方法があげられる。
- 10

- 15 本発明の植物病害防除方法は、通常本発明の殺菌組成物の有効量を病害の発生が予測される植物またはその植物が生育する土壤に処理することにより行われる。

本発明の殺菌組成物は通常、農園芸用殺菌剤、即ち畑地、水田、果樹園、茶園、牧草地、芝生地等における植物病害を防除するための殺菌剤として用いられる。

- 本発明の殺菌組成物は他の殺菌剤、殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、除草剤、植物生長調節剤および／または肥料と共に用いることもできる。
- 20

- かかる殺菌剤としては、例えば、プロピコナゾール、トリアジメノール、プロクロラズ、ペンコナゾール、テブコナゾール、フルシラゾール、ジニコナゾール、ブロムコナゾール、エポキシコナゾール、ジフェノコナゾール、シプロコナゾール、メトコナゾール、トリフルミゾール、テトラコナゾール、マイクロブタニール、フェンブコナゾール、ヘキサコナゾール、フルキンコナゾール、トリティコナゾール、ビテルタノール、イマザリル及びフルトリアホール等のアゾール系殺菌化合物；フェンプロピモルフ、トリデモルフ及びフェンプロピジン等の環状アミン系殺菌化合物；カルベンダジム、ベノミル、チアベンダゾール、チオファネートメチル等のベンズイミダゾール系殺菌化合物；プロシミドン；シプロディニ
- 25

ル；ピリメタニル；ジエトフェンカルブ；チウラム；フルアジナム；マンコゼブ
 ；イプロジオン；ピンクロゾリン；クロロタロニル；キャプタン；メパニピリム
 ；フェンピクロニル；フルジオキシニル；ジクロフルアニド；フォルペット；ク
 レソキシムメチル；アゾキシストロビン；トリフロキシストロビン；ピコキシス
 5 トロビン；ピラクロストロビン；N-メチル- α -メトキシイミノ-2-〔(2,
 5-ジメチルフェノキシ)メチル〕フェニルアセトアミド；スピロキサミン；キ
 ノキシフェン；フェンヘキサミド；ファモキサドン；フェナミドン (R P-40
 7213)；イプロヴァリカルブ；ベンチアバリカルブ；シアゾファミド；ニコビ
 フェン；メトラフェノンおよびシフルフェナミドが挙げられる。

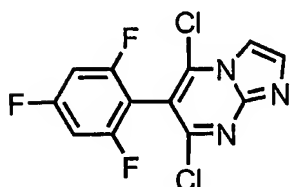
10

以下、本発明を製造例、製剤例および試験例等によりさらに詳しく説明するが、
 本発明はこれらの例に限定されない。

まず、本発明化合物の製造例を示す。

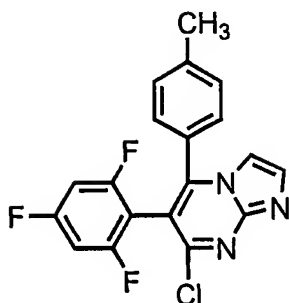
製造例 1

15 5, 7-ジクロロ-6-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル)イミダゾ
 , 2-a]ピリミジン



0.95 g、4-メチルフェニルボロン酸0.49 g、リン酸カリウム水和物1
 .91 g、{1, 1'-ビス(ジフェニルホスフィノ)フェロセン}ジクロロパラ
 20 ジウム (I I) 塩化メチレン錯体73 mg およびエチレングリコールジメチルエ
 ーテル15 mlを混合し、窒素雰囲気下で6時間加熱還流した。その後、反応混
 合物を室温まで放冷してから濾過し、濾液を濃縮した。残渣をクロロホルムに溶
 解して、水、10%水酸化ナトリウム水溶液、水、飽和塩化アンモニウム水溶液
 および水で順次洗浄した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮した
 25 。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付した後、メチル-tert-
 ブチルエーテルとヘキサンの混合液で洗浄し、5-(4-メチルフェニル)-6

ー (2, 4, 6-トリフルオロフェニル) -7-クロロイミダゾ [1, 2-a]
ピリミジン



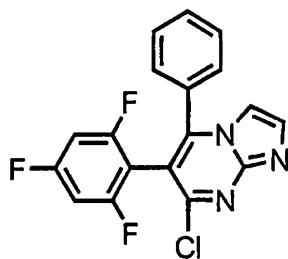
(以下、本発明化合物 (1) と記す。) 0.28 g を得た。

5 融点: 155.1°C

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 2.39 (3H, s), 6.63 (2H, dd, $J=7.1\text{ Hz}$, 8.6 Hz), 7.20–7.25 (4H, m), 7.25 (1H, d, $J=1.5\text{ Hz}$), 7.75 (1H, d, $J=1.5\text{ Hz}$)

10 製造例 2

5, 7-ジクロロ-6-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル) イミダゾ [1, 2-a] ピリミジン 0.48 g、フェニルボロン酸 0.27 g、炭酸カリウム 0.62 g、{1, 1'-ビス (ジフェニルホスフィノ) フェロセン} ジクロロパラジウム (II) 塩化メチレン錯体 31 mg およびトルエン 10 ml を混合し、
15 窒素雰囲気下で 13 時間加熱還流した。その後、反応混合物を室温まで放冷してから濾過した。濾液を水に注加し、トルエンで抽出した。有機層を水、10% 水酸化ナトリウム水溶液、水、飽和塩化アンモニウム水溶液および飽和食塩水で順次洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した後濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付して、5-フェニル-6-(2, 4, 6-トリフルオロ
20 フェニル) -7-クロロイミダゾ [1, 2-a] ピリミジン



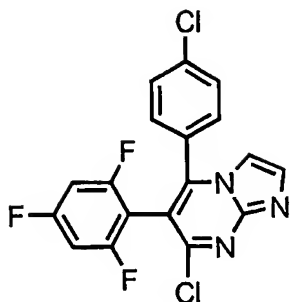
(以下、本発明化合物 (2) と記す。) 0.11 g を得た。

融点: 139.4°C

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 6.63 (2H, dd, $J=7\text{ Hz}, 8\text{ Hz}$), 7.24 (1H, s), 7.3–7.4 (2H, m), 7.4–7.5 (m, 3H), 7.78 (1H, s)

製造例 3

5, 7-ジクロロ-6-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル) イミダゾ [1, 2-a] ピリミジン 0.48 g、4-クロロフェニルボロン酸 0.28 g、炭酸カリウム 0.62 g、{1, 1'-ビス (ジフェニルホスフィノ) フェロセン} ジクロロパラジウム (II) 塩化メチレン錯体 31 mg およびエチレングリコールジメチルエーテル 10 ml を混合し、窒素雰囲気下で 6 時間加熱還流した。その後、反応混合物を室温まで放冷してから濾過し、濾液を濃縮した。残渣をクロロホルムに溶解し、水、10% 水酸化ナトリウム水溶液、水、飽和塩化ナトリウム水溶液および水で順次洗浄した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、得られた粗生成物をエチルアルコール 5 ml およびアンモニア水 5 ml と混合し、3 時間加熱還流した。反応液を濃縮した後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付して、5-(4-クロロフェニル)-6-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル)-7-クロロイミダゾ [1, 2-a] ピリミジン



(以下、本発明化合物 (3) と記す。) 0.16 g を得た。

融点: 156.3°C

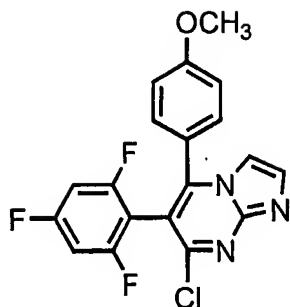
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 6.66 (2H, dd, $J=7\text{ Hz}, 8\text{ Hz}$), 7.20 (1H, d, $J=1\text{ Hz}$), 7.29 (2H, d, $J=8\text{ Hz}$), 7.84 (2H, d, $J=8\text{ Hz}$), 7.79 (1H, d, $J=1\text{ Hz}$)

製造例 4

5, 7-ジクロロ-6-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル) イミダゾ [1, 2-a] ピリミジン 0.48 g、4-メトキシフェニルボロン酸 0.27 g、リン酸カリウム水和物 0.96 g、{1, 1'-ビス (ジフェニルホスフィノ) フェロセン} ジクロロパラジウム (II) 塩化メチレン錯体 37 mg およびエチレングリコールジメチルエーテル 10 ml を混合し、窒素雰囲気下で 4 時間加熱還流した。その後、反応混合物を室温まで放冷してから濾過し、濾液を濃縮した。

15 残渣をクロロホルムに溶解して、水、10%水酸化ナトリウム水溶液、水、飽和塩化アンモニウム水溶液および水で順次洗浄した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付した。得られた粗成生物をエチルアルコール 2 ml に溶解し、ヒドラジーン水和物 34 mg を加え、室温で 2 時間攪拌した。反応液を水に注加し、析出した沈殿を濾

20 取した後、シリカゲルカラムクロマトグラフィーに付して、5-(4-メトキシフェニル)-6-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル)-7-クロロイミダゾ [1, 2-a] ピリミジン



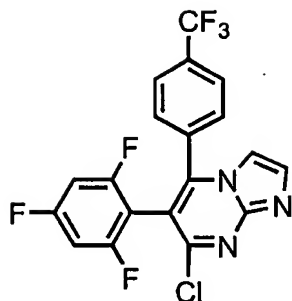
(以下、本発明化合物 (4) と記す。) 0.15 g を得た。

融点: 170.4°C

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 3.84 (3H, s), 6.65 (2H, dd, $J=7\text{ Hz}$, 8 Hz), 6.93 (2H, d, $J=1\text{ Hz}$), 7.27 (2H, d, $J=9\text{ Hz}$), 7.28 (1H, d, $J=2\text{ Hz}$), 7.76 (1H, d, $J=2\text{ Hz}$)

製造例 5

5, 7-ジクロロ-6-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル) イミダゾ [1, 2-a] ピリミジン 0.48 g、4-(トリフルオロメチル) フェニルボロン酸 0.34 g、リン酸カリウム水和物 0.96 g、{1, 1'-ビス (ジフェニルホスフィノ) フェロセン} ジクロロパラジウム (II) 塩化メチレン錯体 37 mg およびエチレングリコールジメチルエーテル 10 ml を混合し、窒素雰囲気下で 2 時間加熱還流した。その後、反応混合物を室温まで放冷してから濾過し、濾液を濃縮した。残渣をクロロホルムに溶解して、水、10% 水酸化ナトリウム水溶液、水、飽和塩化アンモニウム水溶液および水で順次洗浄した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィに付した後、ヘキサンで洗浄し、5-(4-(トリフルオロメチル) フェニル)-6-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル)-7-クロロイミダゾ [1, 2-a] ピリミジン



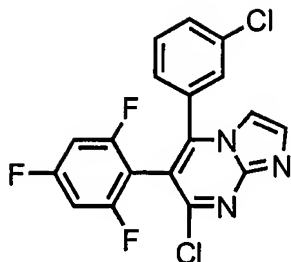
(以下、本発明化合物(5)と記す。) 89mgを得た。

融点: 123.5°C

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 6.67 (2H, dd, $J=7\text{Hz}$, 8Hz), 7.15 (1H, d, $J=1\text{Hz}$), 7.51 (2H, d, $J=8\text{Hz}$), 7.75 (2H, d, $J=8\text{Hz}$), 7.80 (1H, d, $J=1\text{Hz}$)

製造例6

5, 7-ジクロロ-6-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル)イミダゾ[1, 2-a]ピリミジン0.48g、3-クロロフェニルボロン酸0.28g、リン酸カリウム水和物0.96g、{1, 1'-ビス(ジフェニルホスフィノ)フェロセン}ジクロロパラジウム(II)塩化メチレン錯体37mgおよびエチレングリコールジメチルエーテル10mlを混合し、窒素雰囲気下で4時間加熱還流した。その後、反応混合物を室温まで放冷してから濾過し、濾液を濃縮した。残渣をクロロホルムに溶解して、水、10%水酸化ナトリウム水溶液、水、飽和塩化アンモニウム水溶液および水で順次洗浄した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付した。得られた粗成生物をエチルアルコール2mlに溶解し、ヒドラジーン水和物30mgを加え、室温で2時間攪拌した。反応液を水に注加し、クロロホルムで抽出した。有機層を飽和塩化アンモニウム水溶液および水で順次洗浄した後、濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付して、5-(3-クロロフェニル)-6-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル)-7-クロロイミダゾ[1, 2-a]ピリミジン



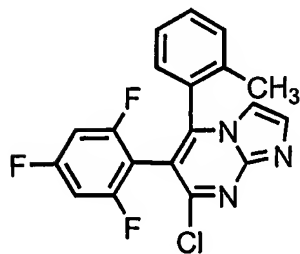
(以下、本発明化合物(6)と記す。) 28mgを得た。

融点: 176.0°C

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 6.6–6.8 (m, 2H), 7.21 (1H, d, $J=1\text{Hz}$), 7.20–7.25 (1H, m), 7.36 (1H, s), 7.41 (1H, t, $J=8\text{Hz}$), 7.45–7.50 (1H, m), 7.80 (1H, d, $J=1\text{Hz}$)

製造例7

5, 7-ジクロロ-6-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル)イミダゾ[1, 2-a]ピリミジン0.48g、2-メチルフェニルボロン酸0.25g、リン酸カリウム水和物0.96g、{1, 1'-ビス(ジフェニルホスフィノ)フェロセン}ジクロロパラジウム(II)塩化メチレン錯体37mgおよびエチレングリコールジメチルエーテル10mlを混合し、窒素雰囲気下で2.5時間加熱還流した。その後、反応混合物を室温まで放冷してから濾過し、濾液を濃縮した。残渣をクロロホルムに溶解して、水、10%水酸化ナトリウム水溶液、水、飽和塩化アンモニウム水溶液および水で順次洗浄した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付して、5-(2-メチルフェニル)-6-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル)-7-クロロイミダゾ[1, 2-a]ピリミジン



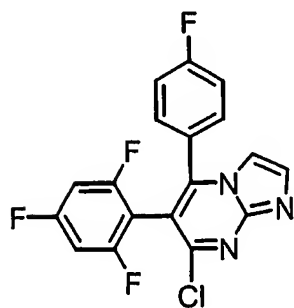
(以下、本発明化合物(7)と記す。) 0.12gを得た。

融点：173.9℃

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 2.07 (3H, s), 6.5–6.7 (2H, m), 6.96 (1H, d, $J=1\text{Hz}$), 7.15 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 7.22 (1H, t, $J=8\text{Hz}$), 7.30 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 7.35–7.41 (1H, m), 7.78 (1H, d, $J=1\text{Hz}$)

製造例 8

5, 7-ジクロロ-6-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル)イミダゾ[1, 2-a]ピリミジン0.95g、4-フルオロフェニルボロン酸0.42g、
 10 リン酸カリウム水和物1.91g、{1, 1'-ビス(ジフェニルホスフィノ)フェロセン}ジクロロパラジウム(II)塩化メチレン錯体73mgおよびエチレングリコールジメチルエーテル15mlを混合し、窒素雰囲気下、50℃で8時間加熱した。その後、反応混合物を室温まで放冷してから10%水酸化ナトリウム水溶液に注加し、メチル-tert-ブチルエーテルで抽出した。有機層を水、
 15 飽和塩化アンモニウム水溶液および水で順次洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付した後、メチル-tert-ブチルエーテルで洗浄し、5-(4-フルオロフェニル)-6-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル)-7-クロロイミダゾ[1, 2-a]ピリミジン



20

(以下、本発明化合物(8)と記す。)0.15gを得た。

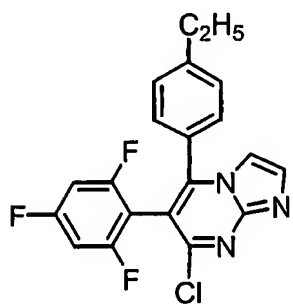
融点：188.7℃

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 6.66 (2H, dd, $J=7.1\text{Hz}$, 8.5Hz), 7.16 (2H, t, $J=8.5\text{Hz}$), 7.2

1 (1H, d, $J=1.5\text{ Hz}$), 7.35 (2H, dd, $J=5.0\text{ Hz}$, 8.5 Hz) 7.79 (1H, d, $J=1.5\text{ Hz}$)

製造例 9

5, 7-ジクロロ-6-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル) イミダゾ [1, 2-a] ピリミジン 0.95 g、4-エチルフェニルボロン酸 0.45 g、リン酸カリウム水和物 1.91 g、{1, 1'-ビス(ジフェニルホスフィノ)フェロセン} ジクロロパラジウム (II) 塩化メチレン錯体 73 mg およびエチレングリコールジメチルエーテル 30 ml を混合し、窒素雰囲気下、50°C で 8 時間加熱した。その後、反応混合物を室温まで放冷してから濾過し、濾液を濃縮した。
 10 残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付した後、得られた粗生成物をエチルアルコール 5 ml およびアンモニア水 5 ml と混合し、3 時間加熱還流した。反応混合物を室温まで放冷してから 10% クエン酸水溶液に注加し、メチル-tert-ブチルエーテルで抽出した。有機層を水洗し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、
 15 5-(4-エチルフェニル)-6-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル)-7-クロロイミダゾ [1, 2-a] ピリミジン



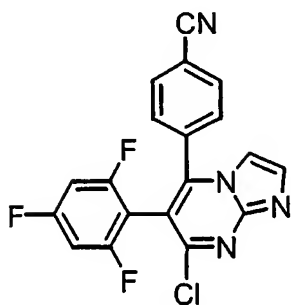
(以下、本発明化合物 (9) と記す。) 80 mg を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 1.25 (3H, t, $J=7.5\text{ Hz}$), 2.68 (2H, q, $J=7.5\text{ Hz}$), 6.6-6.7 (2H, m), 7.2-7.3 (5H, m), 7.74 (1H, d, $J=1.5\text{ Hz}$)

製造例 10

5, 7-ジクロロ-6-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル) イミダゾ [1, 2-a] ピリミジン 0.32 g、4-シアノフェニルボロン酸 0.18 g、炭

酸カリウム 0.42 g、{1, 1'-ビス(ジフェニルホスフィノ)フェロセン}ジクロロパラジウム(II)塩化メチレン錯体 24 mg、モレキュラーシーブス 4A300 g およびエチレングリコールジメチルエーテル 10 ml を混合し、窒素雰囲気下、70℃で8時間加熱した。反応混合物を室温まで放冷した後、濾過し、濾液に10%水酸化ナトリウム水溶液に注加し、クロロホルムで抽出した。有機層を水洗し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付した後、メチル-tert-ブチルエーテルで洗浄し、5-(4-シアノフェニル)-6-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル)-7-クロロイミダゾ[1, 2-a]ピリミジン



10

(以下、本発明化合物(10)と記す。) 10 mg を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 6.68 (2H, dd, $J=7.0\text{ Hz}$, 8.3 Hz), 7.15 (1H, d, $J=1.2\text{ Hz}$), 7.52 (2H, d, $J=8.4\text{ Hz}$), 7.79 (2H, d, $J=8.4\text{ Hz}$), 7.80 (1H)

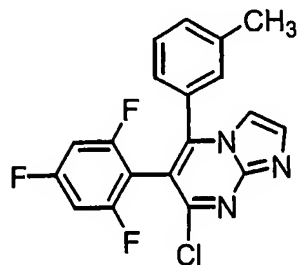
15

製造例 11

5, 7-ジクロロ-6-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル)イミダゾ[1, 2-a]ピリミジン 0.95 g、3-メチルフェニルボロン酸 0.41 g、リン酸カリウム水和物 1.91 g、{1, 1'-ビス(ジフェニルホスフィノ)フェロセン}ジクロロパラジウム(II)塩化メチレン錯体 73 mg およびエチレングリコールジメチルエーテル 30 ml を混合し、窒素雰囲気下、で50℃で8時間加熱した。その後、反応混合物を室温まで放冷してから濾過し、濾液を濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付した後、得られた粗生成物をエチルアルコール 5 ml およびアンモニア水 5 ml と混合し、2時間加熱還流

20

した。反応混合物を室温まで放冷してから10%クエン酸水溶液に注加し、メチル-tert-ブチルエーテルで抽出した。有機層を水洗し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、5-(3-メチルフェニル)-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)-7-クロロイミダゾ[1,2-a]ピリミジン

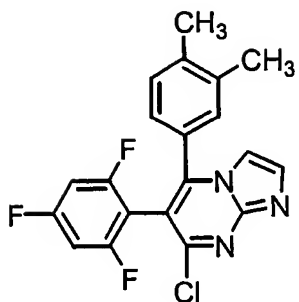


(以下、本発明化合物(11)と記す。) 47mgを得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 2.34 (3H, s), 6.6-6.7 (2H, m), 7.1-7.4 (5H, m), 7.76 (1H, s)

製造例12

5,7-ジクロロ-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)イミダゾ[1,2-a]ピリミジン0.95g、3,4-ジメチルメチルフェニルボロン酸0.45g、リン酸カリウム水和物1.91g、{1,1'-ビス(ジフェニルホスフィノ)フェロセン}ジクロロパラジウム(II)塩化メチレン錯体73mgおよびエチレングリコールジメチルエーテル40mlを混合し、窒素雰囲気下、50℃で10時間加熱した。その後、反応混合物を室温まで放冷してから10%水酸化ナトリウム水溶液に注加し、メチル-tert-ブチルエーテルで抽出した。有機層を水洗し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付した後、得られた粗生成物をエチルアルコール3mlおよびアンモニア水3mlと混合し、1.5時間加熱還流した。反応混合物を濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、5-(3,4-ジメチルフェニル)-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)-7-クロロイミダゾ[1,2-a]ピリミジン

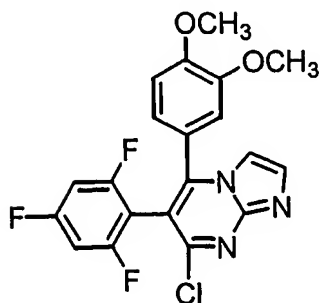


(以下、本発明化合物(12)と記す。) 33mgを得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 2.28 (3H, s),
 2.29 (3H, s), 6.63 (2H, t, $J=8\text{Hz}$), 7.03 (1H,
 5 d, $J=8\text{Hz}$), 7.08 (1H, s), 7.16 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 7.
 2-7.3 (1H, m), 7.74 (1H, d, $J=1\text{Hz}$)

製造例13

5, 7-ジクロロ-6-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル) イミダゾ [1
 , 2-a] ピリミジン 0.95 g、3, 4-ジメトキシメチルフェニルボロン酸
 10 0.55 g、リン酸カリウム水和物 1.91 g、{1, 1'-ビス(ジフェニルホ
 スフィノ) フェロセン} ジクロロパラジウム (II) 塩化メチレン錯体 73 mg
 およびエチレングリコールジメチルエーテル 40 ml を混合し、窒素雰囲気下、
 50℃で8時間加熱した。その後、反応混合物を室温まで放冷してから10%水
 酸化ナトリウム水溶液に注加し、メチル-tert-ブチルエーテルで抽出した
 15 。有機層を水洗し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮した。残渣をシリカ
 ゲルカラムクロマトグラフィーに付した後、酢酸エチルとヘキサンとの混合液で
 洗浄し、5-(3, 4-ジメトキシフェニル)-6-(2, 4, 6-トリフルオ
 ロフェニル)-7-クロロイミダゾ [1, 2-a] ピリミジン

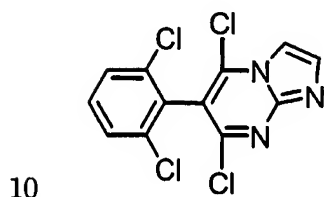


(以下、本発明化合物(13)と記す。) 0.15 gを得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 3.77 (3H, s), 3.91 (3H, s), 6.65 (2H, m), 6.79 (1H, d, $J=2\text{ Hz}$), 6.90 (1H, d, $J=8\text{ Hz}$), 6.94 (1H, dd, $J=2\text{ Hz}$, 8 Hz), 7.32 (1H, d, $J=1\text{ Hz}$), 7.76 (1H, d, $J=1\text{ Hz}$)

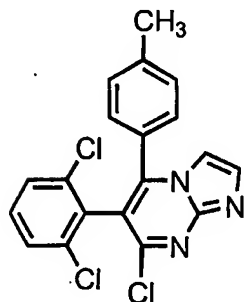
製造例14

5, 7-ジクロロ-6-(2, 6-ジクロロフェニル)イミダゾ[1, 2-a]ピリミジン



0.99 g、4-メチルフェニルボロン酸0.41 g、リン酸カリウム水和物1.91 g、{1, 1'-ビス(ジフェニルホスフィノ)フェロセン}ジクロロパラジウム(II)塩化メチレン錯体73 mgおよびエチレングリコールジメチルエーテル15 mlを混合し、窒素雰囲気下、60℃で9時間加熱した。その後、反応混合物を室温まで放冷してから10%水酸化ナトリウム水溶液に注加し、メチル-tert-ブチルエーテルで抽出した。有機層を水、飽和塩化アンモニウム水溶液および水で順次洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付した後、エチルアルコールで洗浄し、5-(4-メチルフェニル)-6-(2, 6-ジクロロフェニル)-7-クロロイミダゾ[1, 2-a]ピリミジン

20



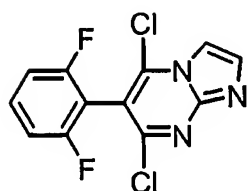
(以下、本発明化合物 (14) と記す。) 0.12 g を得た。

融点: 224.4°C

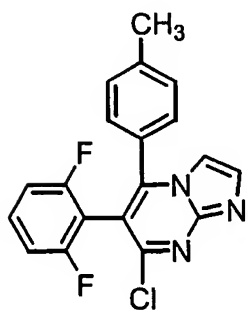
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 2.36 (3H, s), 7.18–7.24 (3H, m), 7.27 (1H, d, $J=1.5\text{ Hz}$), 7.29–7.33 (4H, m), 7.76 (1H, d, $J=1.5\text{ Hz}$)

製造例 15

5, 7-ジクロロ-6-(2, 6-ジフルオロフェニル) イミダゾ [1, 2-a] ピリミジン



- 10 0.90 g、4-メチルフェニルボロン酸 0.41 g、リン酸カリウム水和物 1.91 g、{1, 1'-ビス (ジフェニルホスフィノ) フェロセン} ジクロロパラジウム (II) 塩化メチレン錯体 73 mg およびエチレングリコールジメチルエーテル 15 ml を混合し、窒素雰囲気下、60°C で 10 時間加熱した。その後、反応混合物を室温まで放冷してから 10% 水酸化ナトリウム水溶液に注加し、メチル-tert-ブチルエーテルで抽出した。有機層を水、飽和塩化アンモニウム水溶液および水で順次洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付した後、メチル-tert-ブチルエーテルで洗浄し、5-(4-メチルフェニル)-6-(2, 6-ジフルオロフェニル)-7-クロロイミダゾ [1, 2-a] ピリミジン



20

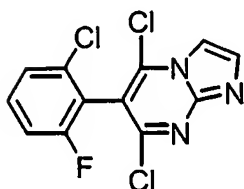
(以下、本発明化合物 (15) と記す。) 0.16 g を得た。

融点：220.2℃

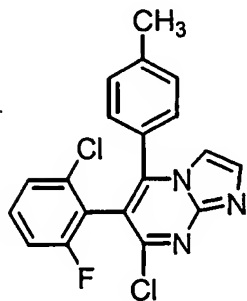
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 2.36 (3H, s), 6.86 (2H, m), 7.19–7.25 (4H, m), 7.26 (1H), 7.30 (1H, m), 7.75 (1H, d, $J=1.5\text{ Hz}$)

5 製造例16

5, 7-ジクロロ-6-(2-クロロ-6-フルオロフェニル)イミダゾ[1, 2-a]ピリミジン



0.95 g、4-メチルフェニルボロン酸0.41 g、リン酸カリウム水和物1
 10 .91 g、{1, 1'-ビス(ジフェニルホスフィノ)フェロセン}ジクロロパラジウム(II)塩化メチレン錯体73 mgおよびエチレングリコールジメチルエーテル40 mlを混合し、窒素雰囲気下、60℃で7時間加熱した。その後、反応混合物を室温まで放冷してから10%水酸化ナトリウム水溶液に注加し、メチル-tert-ブチルエーテルで抽出した。有機層を水、飽和塩化アンモニウム
 15 水溶液および水で順次洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付した後、メチル-tert-ブチルエーテルで洗浄し、5-(4-メチルフェニル)-6-(2-クロロ-6-フルオロフェニル)-7-クロロイミダゾ[1, 2-a]ピリミジン



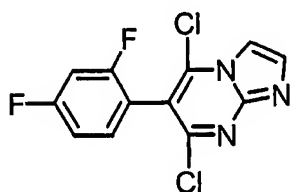
20 (以下、本発明化合物(16)と記す。)0.14 gを得た。

融点：230.9℃

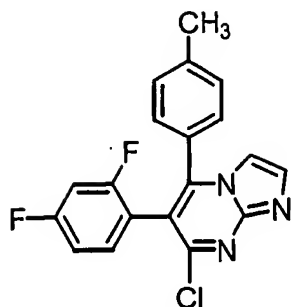
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 2.36 (3H, s), 6.96 (1H, dt, $J=1.0\text{ Hz}$, 8.3 Hz), 7.18–7.26 (4H, m), 7.20 (1H), 7.26–7.30 (2H, m), 7.75 (1H, d, $J=1.5\text{ Hz}$)

5 製造例17

5, 7-ジクロロ-6-(2, 4-ジフルオロフェニル)イミダゾ[1, 2-a]ピリミジン



- 0.90 g、4-メチルフェニルボロン酸0.41 g、リン酸カリウム水和物1
 10 .91 g、{1, 1'-ビス(ジフェニルホスフィノ)フェロセン}ジクロロパラジウム(II)塩化メチレン錯体73 mgおよびエチレングリコールジメチルエーテル40 mlを混合し、窒素雰囲気下、60℃で7時間加熱した。その後、反応混合物を室温まで放冷してから10%水酸化ナトリウム水溶液に注加し、メチル-tert-ブチルエーテルで抽出した。有機層を水、飽和塩化アンモニウム
 15 水溶液および水で順次洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付した後、得られた粗生成物をエチルアルコール5 mlおよびアンモニア水5 mlと混合し、3時間加熱還流した。反応混合物を室温まで放冷してから10%クエン酸水溶液に注加し、メチル-tert-ブチルエーテルで抽出した。有機層を水洗し、無水硫酸ナトリウムで乾
 20 燥した後、濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、5-(4-メチルフェニル)-6-(2, 4-ジフルオロフェニル)-7-クロロイミダゾ[1, 2-a]ピリミジン



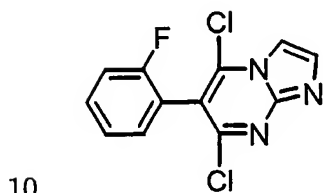
(以下、本発明化合物(17)と記す。) 0.11 gを得た。

融点: 164.5°C

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 2.37 (3H, s),
 5 6.76–6.83 (2H, m), 7.03–7.09 (4H, m), 7.25 (1H), 7.74 (1H, d, $J=1.5\text{ Hz}$)

製造例 18

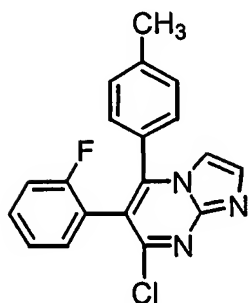
5,7-ジクロロ-6-(2-フルオロフェニル)イミダゾ[1,2-a]ピ
 リミジン



10

0.85 g、4-メチルフェニルボロン酸 0.41 g、リン酸カリウム水和物 1.91 g、{1,1'-ビス(ジフェニルホスフィノ)フェロセン}ジクロロパラジウム(II)塩化メチレン錯体 73 mg およびエチレングリコールジメチルエーテル 40 ml を混合し、窒素雰囲気下、60°C で 6 時間加熱した。その後、反
 15 応混合物を室温まで放冷してから 10% 水酸化ナトリウム水溶液に注加し、メチル-tert-ブチルエーテルで抽出した。有機層を水洗し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付した後、得られた粗生成物をエチルアルコール 10 ml およびアンモニア水 5 ml と混合し、6 時間加熱還流した。反応混合物を室温まで放冷してから 10% ク
 20 エン酸水溶液に注加し、メチル-tert-ブチルエーテルで抽出した。有機層を水洗し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮した。残渣をメチル-tert-

ーブチルエーテルで洗浄し、5-(4-メチルフェニル)-6-(2-フルオロフェニル)-7-クロロイミダゾ[1, 2-a]ピリミジン



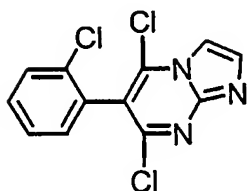
(以下、本発明化合物(18)と記す。) 0.15 gを得た。

5 融点: 188.6°C

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 2.35 (3H, s), 7.00-7.09 (3H, m), 7.18 (4H, s), 7.25 (1H, s), 7.27-7.31 (1H, m), 7.74 (1H, s)

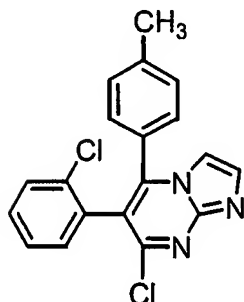
製造例19

10 5, 7-ジクロロ-6-(2-クロロフェニル)イミダゾ[1, 2-a]ピリミジン



0.90 g、4-メチルフェニルボロン酸0.41 g、リン酸カリウム水和物1.91 g、{1, 1'-ビス(ジフェニルホスフィノ)フェロセン}ジクロロパラ
 15 ジウム(II)塩化メチレン錯体73 mgおよびエチレングリコールジメチルエーテル40 mlを混合し、窒素雰囲気下、50°Cで6時間加熱した。その後、反応混合物を室温まで放冷してから10%水酸化ナトリウム水溶液に注加し、メチル
 20 ルーtert-ブチルエーテルで抽出した。有機層を水、飽和塩化アンモニウム水溶液で順次洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付した後、得られた粗生成物をエチルアルコール10 mlおよびアンモニア水5 mlと混合し、18時間加熱還流した。反応

混合物を室温まで放冷してから10%クエン酸水溶液に注加し、メチル-tert-ブチルエーテルで抽出した。有機層を水洗し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮した。残渣を残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付した後、メチル-tert-ブチルエーテルで洗浄し、5-(4-メチルフェニル)-6-(2-クロロフェニル)-7-クロロイミダゾ[1,2-a]ピリミジン



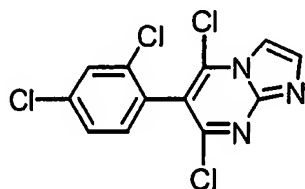
(以下、本発明化合物(19)と記す。) 0.10 gを得た。

融点: 211.5°C

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 2.34 (3H, s),
 10 7.09 (1H, dd, $J=2\text{Hz}, 8\text{Hz}$), 7.17 (1H, t, $J=8\text{Hz}$),
 7.15-7.25 (4H, m), 7.26 (1H, dt, $J=2\text{Hz}, 8\text{Hz}$),
 7.26 (1H), 7.38 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 7.74 (1H, d, $J=1\text{Hz}$)

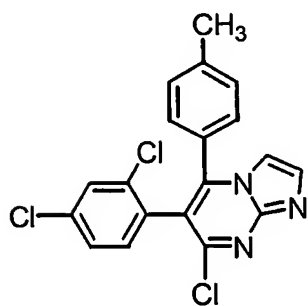
製造例20

15 5,7-ジクロロ-6-(2,4-ジクロロフェニル)イミダゾ[1,2-a]
]ピリミジン



1.32 g、4-メチルフェニルボロン酸0.54 g、リン酸カリウム水和物2.53 g、{1,1'-ビス(ジフェニルホスフィノ)フェロセン}ジクロロパラ
 20 ジウム(II)塩化メチレン錯体97 mgおよびエチレングリコールジメチルエーテル50 mlを混合し、窒素雰囲気下、50°Cで8時間加熱した。その後、反

応混合物を室温まで放冷してから濾過し、濾液を濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付した後、エチルアルコールで洗浄し、5-(4-メチルフェニル)-6-(2,4-ジクロロフェニル)-7-クロロイミダゾ[1,2-a]ピリミジン



5

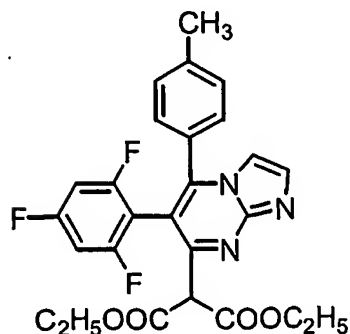
(以下、本発明化合物(20)と記す。) 95mgを得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 2.37 (3H, s), 7.03 (1H, d, $J=8.1\text{ Hz}$), 7.1–7.3 (6H, m), 7.41 (1H, d, $J=2.0\text{ Hz}$), 7.75 (1H, d, $J=1.7\text{ Hz}$)

10 製造例21

水素化ナトリウム(60%油性) 80mgをテトラヒドロフラン5mlに懸濁し、マロン酸ジエチル0.32gのテトラヒドロフラン溶液および本発明化合物(1) 0.37gのテトラヒドロフラン溶液を室温で順次滴下した後、50℃で20時間加熱した。反応混合物を室温まで放冷してから、10%クエン酸水溶液に注加し、メチル-tert-ブチルエーテルで抽出した。有機層を水洗し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、[5-(4-メチルフェニル)-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)イミダゾ[1,2-a]ピリミジン-7-イル] マロン酸ジエチル

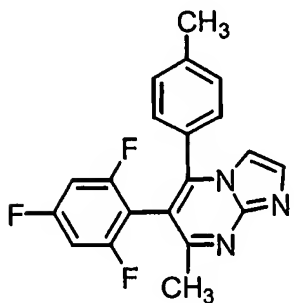
15



0.21 gを得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 1.24 (6H, t, $J=7.1\text{ Hz}$), 2.37 (3H, s), 4.1–4.3 (4H, m), 4.75 (1H, s), 6.62 (2H, dd, $J=7.1\text{ Hz}$, 8.6 Hz), 7.20 (4H, s), 7.25 (1H, d, $J=1.4\text{ Hz}$), 7.77 (1H, d, $J=1.4\text{ Hz}$)

[5-(4-メチルフェニル)-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)イミダゾ[1,2-a]ピリミジン-7-イル] マロン酸ジエチル 0.20 g および濃塩酸 5 ml を混合し、 80°C で 1 時間加熱した。反応混合物を室温まで放冷してから、10%水酸化ナトリウム水溶液に注加し、メチル-tert-ブチルエーテルで抽出した。有機層を水洗し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、5-(4-メチルフェニル)-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)-7-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリミジン



(以下、本発明化合物 (21) と記す。) 0.12 gを得た。

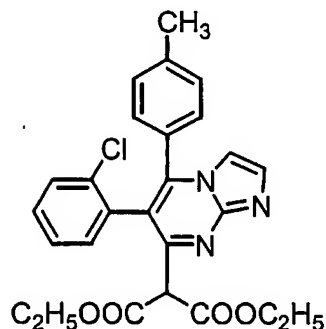
融点: 186.5°C

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 2.37 (3H, s), 2.43 (3H, s), 6.63 (2H, m), 7.16 (1H, s), 7.19 (4H, m), 7.69 (1H, s)

製造例 22

水素化ナトリウム (60%油性) 0.16 g をテトラヒドロフラン 2 ml に懸濁し、マロン酸ジエチル 0.64 g のテトラヒドロフラン溶液および本発明化合物 (19) 0.35 g のテトラヒドロフラン溶液を室温で順次滴下した後、9 時

間加熱還流した。反応混合物を室温まで放冷してから、10%クエン酸水溶液に注加し、メチル-tert-ブチルエーテルで抽出した。有機層を水洗し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、[5-(4-メチルフェニル)-6-(2-クロロフェニル)イミダゾ[1, 2-a]ピリミジン-7-イル] マロン酸ジエチル

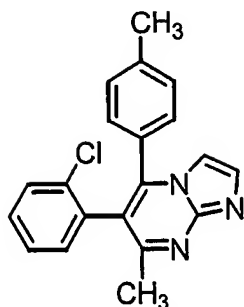


0.37 gを得た。

融点：127.3°C

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 1.13 (3H, t, $J=7.2\text{ Hz}$), 1.30 (3H, t, $J=7.2\text{ Hz}$), 2.33 (3H, s), 4.0-4.1 (2H, m), 4.2-4.4 (2H, m), 4.71 (1H, s), 7.07 (1H, dd, $J=1.7\text{ Hz}$, 7.6 Hz), 7.1-7.3 (7H, m), 7.38 (1H, dd, $J=0.7\text{ Hz}$; 8.0 Hz), 7.76 (1H, d, $J=1.4\text{ Hz}$)

15 [5-(4-メチルフェニル)-6-(2-クロロフェニル)イミダゾ[1, 2-a]ピリミジン-7-イル] マロン酸ジエチル 0.26 g および濃塩酸 2 ml を混合し、0.5時間加熱還流した。反応混合物を室温まで放冷してから、10%水酸化ナトリウム水溶液に注加し、クロロホルムで抽出した。有機層を水洗し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、5-(4-メチルフェニル)-6-(2-クロロフェニル)-7-メチルイミダゾ[1, 2-a]ピリミジン



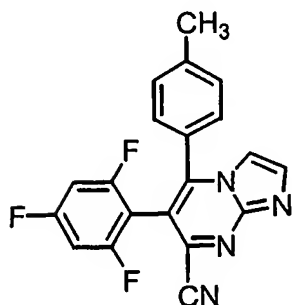
(以下、本発明化合物(22)と記す。) 0.15 gを得た。

融点: 229.9°C

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 2.33 (3H, s),
 5 2.38 (3H, s), 7.06 (1H, dd, $J=1.6\text{ Hz}$, 7.6 Hz),
 7.10–7.26 (7H, m), 7.39 (1H, dd, $J=1.2\text{ Hz}$, 8.
 0 Hz), 7.69 (1H, d, $J=1.5\text{ Hz}$)

製造例 23

本発明化合物(1) 0.12 g、シアン化カリウム 39 mg、ジベンゾー１８
 10 ークラウンー 6 0.15 g および N,N-ジメチルホルムアミド 3 ml とを混
 合し、100°Cで3時間加熱した。反応混合物に室温で水を注加し、メチルー t
 e r t ーブチルエーテルで抽出した。有機層を10%水酸化ナトリウムおよび水
 で順次洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮した。残渣をシリカゲル
 15 , 6-トリフルオロフェニル) – 7-シアノイミダゾ [1, 2-a] ピリミジン



(以下、本発明化合物(23)と示す。) 58 mgを得た。

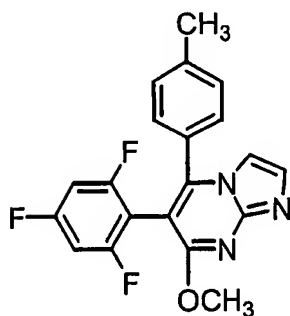
融点: 205.2°C

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 2.41 (3H, s),

6. 70 (2H, dd, $J=7.1\text{ Hz}$, 8.6 Hz), 7. 20–7. 29 (4H, m), 7. 54 (1H, d, $J=1.5\text{ Hz}$), 8. 06 (1H, d, $J=1.5\text{ Hz}$)

製造例 24

- 5 本発明化合物 (1) 0. 17 g、ナトリウムメトキシド (28%メタノール溶液) 0. 13 g およびメタノール 2 ml とを室温で混合した。一晩放置した後、反応混合物に水を注加し、クロロホルムで抽出した。有機層を水洗し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、5-(4-メチルフェニル)-6-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル)-7-メトキシイミダゾ[1, 2-a]ピリミジン
- 10 ン



(以下、本発明化合物 (24) と示す。) 0. 15 g を得た。

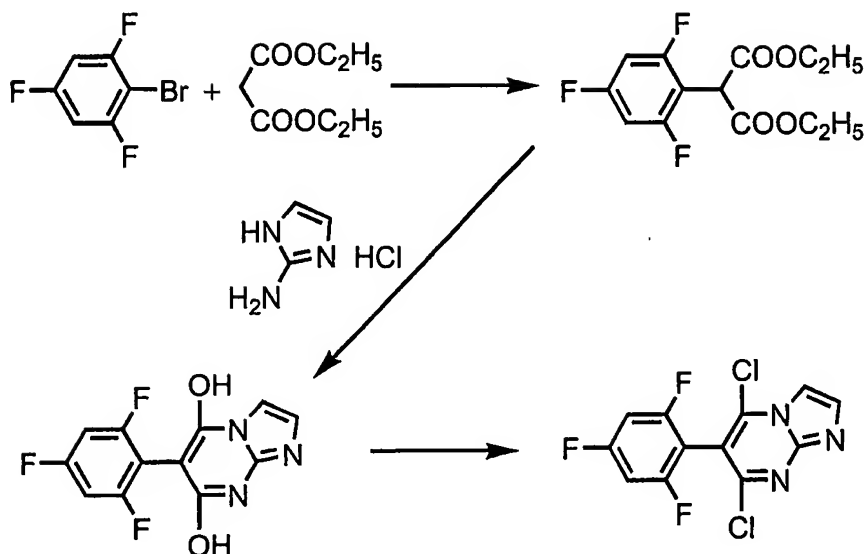
融点: 231. 8°C

- $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 2. 37 (3H, s),
- 15 4. 04 (3H, s), 6. 58 (2H, dd, $J=7.1\text{ Hz}$, 8.6 Hz),
7. 06 (1H, d, $J=1.7$), 7. 20 (4H, s), 7. 47 (1H, d, $J=1.7\text{ Hz}$)

次に本発明化合物の製造中間体の製造法を参考製造例として記す。

- 20 参考製造例 1

88



水素化ナトリウム（60%油性）4.8 gを1,4-ジオキサン100 mlに懸濁し、室温でマロン酸ジエチル19.2 gを滴下した。その後、この混合物に40℃で臭化銅（I）17.2 gと1-ブromo-2,4,6-トリフルオロベンゼン21.1 gとを順次加え、26時間加熱還流した。その後、反応混合物を氷冷してから、反応混合物に濃塩酸を加え、tert-ブチルメチルエーテルと水とで分液した。有機層を水酸化ナトリウム水溶液、希塩酸、水で順次洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付して（2,4,6-トリフルオロフェニル）マロン酸ジエチル12.6 gを得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 1.28 (6H, t, $J=7.1\text{ Hz}$), 4.26 (4H, q, $J=7.1\text{ Hz}$), 4.89 (1H, s), 6.71 (2H, t, $J=8.2\text{ Hz}$)

（2,4,6-トリフルオロフェニル）マロン酸ジエチル2.9 g、2-アミノイミダゾール塩酸塩2.39 g、DBU4.57 gおよびN,N-ジメチルホルムアミド10 mlの混合物を100℃で6時間攪拌した。その後、反応混合物を室温まで放冷し、反応混合物にクロロホルムを加え、水で2回抽出した。水層をあわせて濃縮した。得られた残渣に水10 mlを加えた。その溶液に氷冷下で濃塩酸を加えた。析出した沈殿を濾取、乾燥して5,7-ジヒドロキシ-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)イミダゾ[1,2-a]ピリミジン2.2

gを得た。

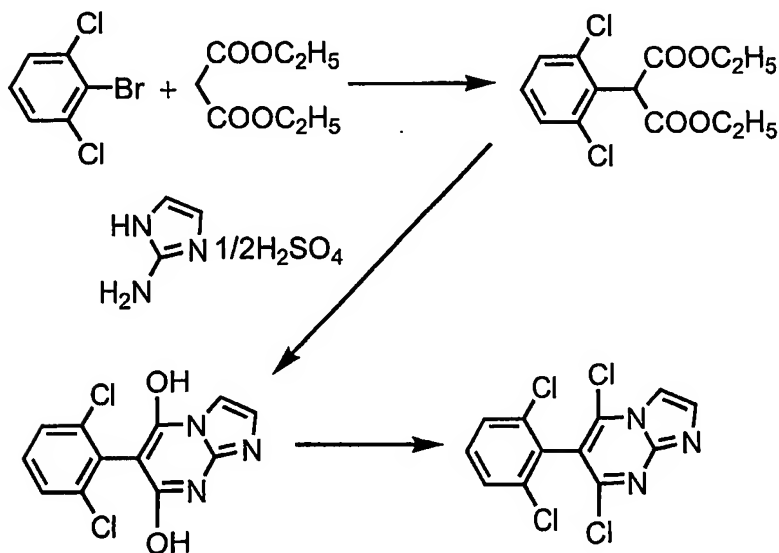
$^1\text{H-NMR}$ ($\text{DMSO}-d_6$, TMS) δ (ppm): 7.11 (2H, dd, $J=7.7\text{ Hz}$, 9.2 Hz), 7.39 (1H, d, $J=2.5\text{ Hz}$), 7.48 (1H, d, $J=2.5\text{ Hz}$), 11.9 (2H, brs)

- 5 5, 7-ジヒドロキシー-6-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル) イミダゾ
[1, 2-a] ピリミジン 2.11 g とオキシ塩化リン 5 ml との混合物を 24
時間加熱還流した。その後、反応混合物を濃縮した。残渣を少量のジクロロメタ
ンに溶解し、この溶液に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加えた。これを、ジク
ロロメタンで抽出した。有機層を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和食塩水で
10 順次洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮した。残渣をシリカゲルカ
ラムクロマトグラフィーに付して 5, 7-ジクロロ-6-(2, 4, 6-トリフ
ルオロフェニル) イミダゾ [1, 2-a] ピリミジン 1.39 g を得た。

融点: 192.5°C

- $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 6.88 (2H, dd, $J=8.6\text{ Hz}$, 7.1 Hz), 7.75 (1H, d, $J=1\text{ Hz}$), 7.92
15 (1H, d, $J=1\text{ Hz}$)

参考製造例 2



- 水素化ナトリウム (60%油性) 5.6 g を 1, 4-ジオキサン 70 ml に懸
20 濁し、60°C でマロン酸ジエチル 22.4 g を滴下した。その後、この混合物に

60℃で臭化銅(I) 10.2 gと1-ブromo-2,6-ジクロロベンゼン15.8 gとを順次加え、21時間加熱還流した。その後、反応混合物を氷冷してから、反応混合物に濃塩酸を加え、メチル-tert-ブチルエーテルと水とで分液した。有機層を希塩酸、水で順次洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮した。残渣を減圧蒸留して、(2,6-ジクロロフェニル)マロン酸ジエチル 7.59 gを得た。

沸点: 130-144℃ (0.14 mmHg)

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 1.28 (6H, t, $J=7.1\text{ Hz}$), 4.26 (4H, q, $J=7.1\text{ Hz}$), 5.44 (1H, s), 7.18-7.23 (1H, m), 7.35 (2H, q, $J=7.8\text{ Hz}$)

(2,6-ジクロロフェニル)マロン酸ジエチル 7.32 g、2-アミノイミダゾール硫酸塩 3.81 g、DBU 8.04 gおよびN,N-ジメチルホルムアミド 15 mlの混合物を100℃で6時間攪拌した。その後、反応混合物に水 20 mlを加えてから室温まで放冷した。生じた沈殿を濾取、乾燥して5,7-ジヒドロキシー-6-(2,6-ジクロロフェニル)イミダゾ[1,2-a]ピリミジン・DBU塩 5.17 gを得た。

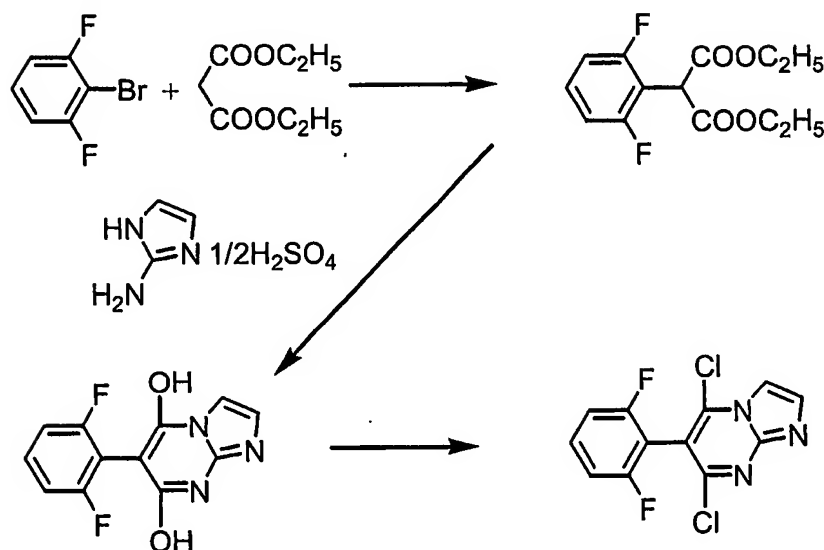
$^1\text{H-NMR}$ ($\text{DMSO}-d_6$, TMS) δ (ppm): 1.59-1.67 (6H, m), 1.87-1.94 (2H, m), 2.49-2.51 (2H, m), 3.23 (2H, t, $J=5.6\text{ Hz}$), 3.46 (2H, t, $J=5.7\text{ Hz}$), 3.52-3.56 (2H, m), 6.69 (1H, d, $J=1.5\text{ Hz}$), 7.09 (1H, d, $J=1.5\text{ Hz}$), 7.15-7.20 (1H, m), 7.35 (2H, d, $J=8.0\text{ Hz}$), 9.5 (br s), 10.3 (br s)

5,7-ジヒドロキシー-6-(2,6-ジクロロフェニル)イミダゾ[1,2-a]ピリミジン・DBU塩 4.48 gとオキシ塩化リン 20 mlとの混合物を16時間加熱還流した。その後、反応混合物を室温まで放冷した後、濃縮した。残渣を少量のクロロホルムに溶解し、この溶液に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加えた。これをクロロホルムで抽出した。有機層を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、水で順次洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付して5,7-ジクロロ-6-(2,6-

ジクロロフェニル) イミダゾ [1, 2-a] ピリミジン 2.64 g を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 7.41–7.46 (1H, m), 7.50–7.53 (2H, m), 7.76 (1H, d, $J=1.5$ Hz), 7.92 (1H, d, $J=1.4$ Hz)

5 参考製造例 3



水素化ナトリウム (60%油性) 8.00 g と 1,4-ジオキサン 100 ml との混合物に、60℃でマロン酸ジエチル 32.0 g を滴下した後、臭化銅 (I) 14.6 g と 1-ブロモ-2,6-ジフルオロベンゼン 19.3 g とを順次加え、16時間加熱還流した。反応混合物に氷冷下濃塩酸を加えた後、tert-ブチルメチルエーテルと水とを加え、分液した。有機層を希塩酸、水で順次洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮した。残渣を減圧下に蒸留し、(2,6-ジフルオロフェニル) マロン酸ジエチル 16.5 g を得た。

沸点: 107℃–109℃ (0.14 mmHg)

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 1.28 (6H, t, $J=7.1$ Hz), 4.26 (4H, q, $J=7.1$ Hz), 4.96 (1H, s), 6.93 (2H, m), 7.30 (1H, m)

(2,6-ジフルオロフェニル) マロン酸ジエチル 13.6 g、2-アミノイミダゾール硫酸塩 7.93 g、DBU 9.13 g および N,N-ジメチルホルムアミド 30 ml の混合物を 100℃で7時間加熱した。反応混合物に水を加え、

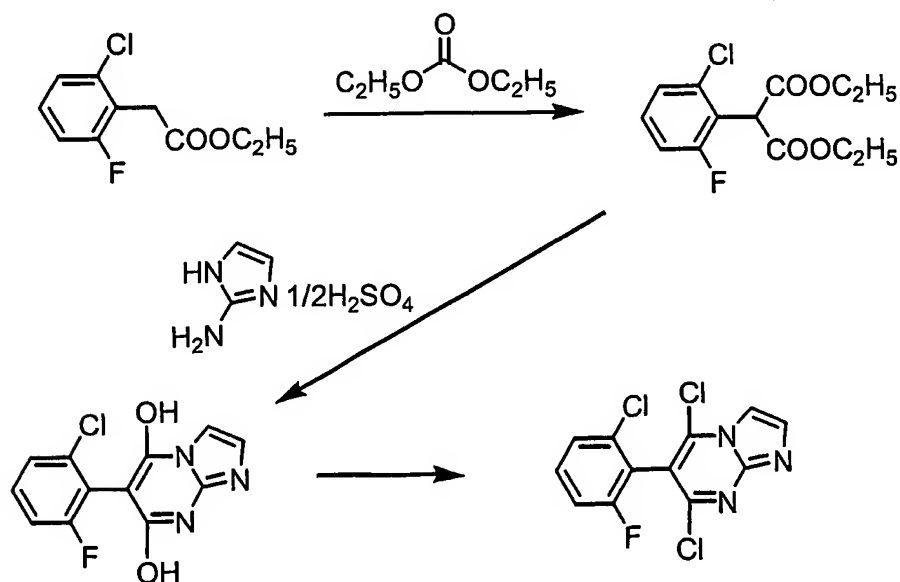
室温まで放冷した後、*t*-ブチルメチルエーテルとで分液した。水層に濃塩酸を加え、析出した沈殿を濾取、乾燥して5, 7-ジヒドロキシ-6-(2, 6-ジフルオロフェニル)イミダゾ[1, 2-a]ピリミジン7.84 gを得た。

¹H-NMR (DMSO-d₆, TMS) δ (ppm): 7.05 (2H, t, J=8 Hz), 7.3-7.4 (1H, m), 7.40 (1H, d, J=2 Hz), 7.49 (1H, d, J=2 Hz), 11.94 (2H, br s)

5, 7-ジヒドロキシ-6-(2, 6-ジフルオロフェニル)イミダゾ[1, 2-a]ピリミジン7.63 g、DBU4.85 gおよびオキシ塩化リン29 mlの混合物を、還流条件下10時間加熱した。反応混合物を濃縮した後、残渣にクロロホルムと飽和炭酸水素ナトリウム水溶液とを加え、分液した。有機層を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、5, 7-ジクロロ-6-(2, 6-ジフルオロフェニル)イミダゾ[1, 2-a]ピリミジン2.48 gを得た。

¹H-NMR (CDCl₃, TMS) δ (ppm): 7.09 (2H, d, J=7.5 Hz, 8.2 Hz), 7.5-7.6 (1H, m), 7.74 (1H, d, J=1.7 Hz), 7.90 (1H, d, J=1.2 Hz)

参考製造例4



水素化ナトリウム（60%油性）7.2 gと炭酸ジエチル17.0 gとテトラヒドロフラン150 mlとの混合物に、還流条件下に、2-クロロ-6-フルオロフェニル酢酸エチル26.0 gを滴下し、8時間還流条件下に加熱した。反応混合物を放冷後、氷冷した希塩酸へ注加し、t-ブチルメチルエーテルで抽出した。有機層を水洗し、硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮した。残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付し、（2-クロロ-6-フルオロフェニル）マロン酸ジエチル30.4 gを得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 1.28 (6H, t, $J=7.1\text{ Hz}$), 4.26 (4H, q, $J=7.1\text{ Hz}$), 5.16 (1H, s), 7.0-7.1 (1H, m), 7.2-7.4 (2H, m)

（2-クロロ-6-フルオロフェニル）マロン酸ジエチル2.89 gとアミノイミダゾール塩酸塩1.20 gと1,5-ジアザビシクロ[4,3,0]-5-ノネン（DBN）2.48 gとN,N-ジメチルホルムアミド（DMF）10 mlとの混合物を、100°Cで4時間加熱した。反応混合物を放冷後、析出した沈殿を濾取、乾燥し、5,7-ジヒドロキシー6-（2-クロロ-6-フルオロフェニル）イミダゾ[1,2-a]ピリミジン・DBN塩1.80 gを得た。

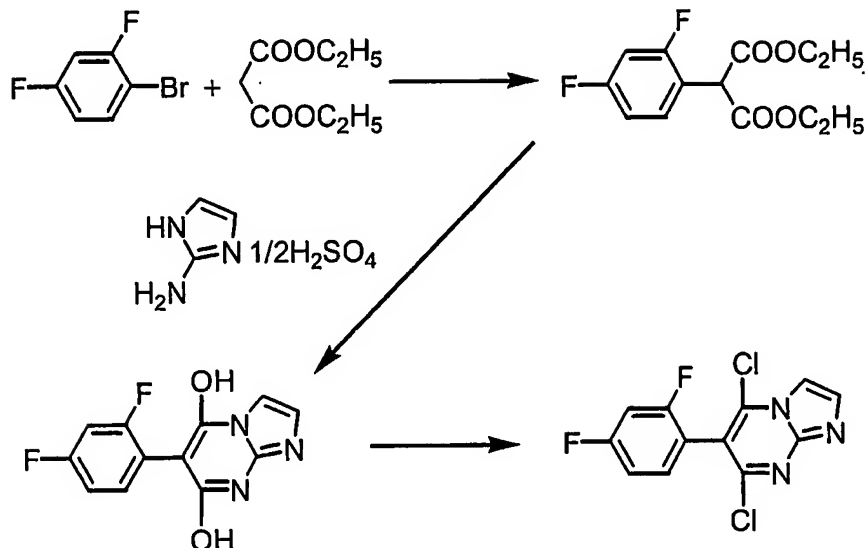
$^1\text{H-NMR}$ ($\text{DMSO}-d_6$, TMS) δ (ppm): 1.8-1.9 (2H, m), 1.9-2.0 (2H, m), 2.76 (2H, t, $J=7.9\text{ Hz}$), 3.27 (2H, t, $J=5.7$), 3.35 (2H, t, $J=5.7\text{ Hz}$), 3.58 (2H, t, $J=7.2\text{ Hz}$), 6.69 (1H, d, $J=1.6\text{ Hz}$), 7.0-7.1 (1H, m), 7.07 (1H, d, $J=1.6\text{ Hz}$), 7.1-7.2 (2H, m), 10.35 (2H, brs)

5,7-ジヒドロキシー6-（2-クロロ-6-フルオロフェニル）イミダゾ[1,2-a]ピリミジン・DBN塩1.62 gとオキシ塩化リン5 mlとの混合物を10時間、還流条件下に加熱した。反応混合物を濃縮した。残渣にジクロロメタンと飽和炭酸水素ナトリウム水溶液とを加え、分液した。有機層を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液および水で順次洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮した。残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付し、5,7-ジクロロ-6-（2-クロロ-6-フルオロフェニル）イミダゾ[1,2-a]ピリミジン1.0

0 gを得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 7.1–7.2 (1 H, m), 7.4–7.6 (2 H, m), 7.76 (1 H, d, $J=1\text{ Hz}$), 7.92 (1 H, d, $J=1\text{ Hz}$)

5 参考製造例 5



水素化ナトリウム (60%油性) 8.00 g と 1,4-ジオキサン 100 ml との混合物に、60℃でマロン酸ジエチル 32.0 g を滴下した後、臭化銅 (I) 14.6 g と 1-ブロモ-2,4-ジフルオロベンゼン 19.3 g とを順次加え、20時間加熱還流した。反応混合物に氷冷下濃塩酸を加えた後、tert-ブチルメチルエーテルと水とを加え、分液した。有機層を希塩酸、水で順次洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮した。残渣を減圧下に蒸留し、(2,6-ジフルオロフェニル) マロン酸ジエチル 12.5 g を得た。

沸点: 107℃ – 113℃ (0.2 mmHg)

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 1.2–1.3 (6 H, m), 4.2–4.3 (4 H, m), 4.92 (1 H, s), 6.84 (1 H, m), 6.91 (1 H, m), 7.4–7.6 (1 H, m)

(2,4-ジフルオロフェニル) マロン酸ジエチル 12.0 g、2-アミノイミダゾール硫酸塩 6.99 g、DBU 14.8 g および N,N-ジメチルホルムアミド 26 ml の混合物を 100℃で6時間加熱した。反応混合物に水を加え、

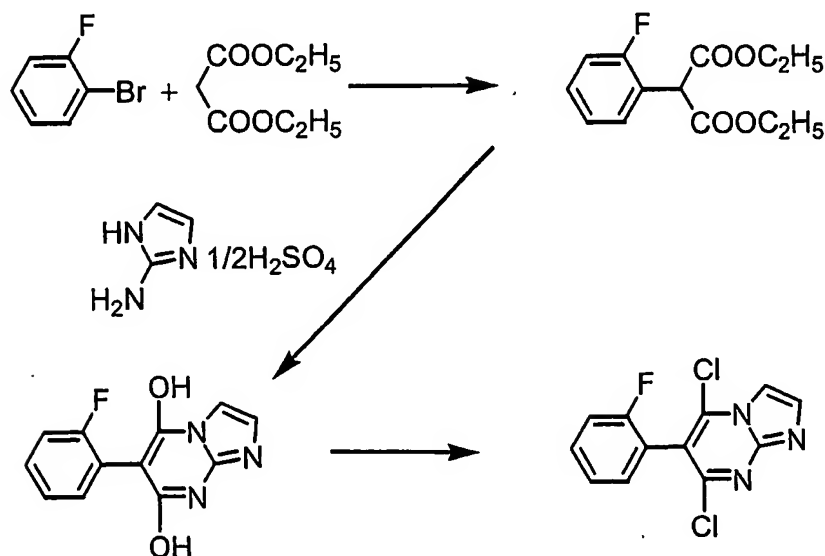
室温まで放冷した後、*t*-ブチルメチルエーテルとで分液した。水層に濃塩酸を加え、析出した沈殿を濾取、乾燥して5, 7-ジヒドロキシ-6-(2, 4-ジフルオロフェニル) イミダゾ [1, 2-a] ピリミジン5.80gを得た。

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 7.04 (1H, dt, $J=2.4\text{ Hz}$, 8.5 Hz), 7.16 (1H, dt, $J=2.6\text{ Hz}$, 9.7 Hz), 7.34 (1H, dt, $J=7.0\text{ Hz}$, 8.5 Hz), 7.40 (1H, d, $J=2.4\text{ Hz}$), 7.49 (1H, d, $J=2.4\text{ Hz}$)

5, 7-ジヒドロキシ-6-(2, 4-ジフルオロフェニル) イミダゾ [1, 2-a] ピリミジン5.80g、DBU3.68gおよびオキシ塩化リン22m
10 lの混合物を、還流条件下7時間加熱した。反応混合物を濃縮した後、残渣にクロロホルムと飽和炭酸水素ナトリウム水溶液とを加え、分液した。有機層を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、5, 7-ジクロロ-6-(2, 4-ジフルオロフェニル) イミダゾ [1, 2-a] ピリミ
15 ジン1.82gを得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl $_3$, TMS) δ (ppm): 6.9-7.1 (2H, m), 7.2-7.3 (1H, m), 7.73 (1H, d, $J=1.5\text{ Hz}$), 7.90 (1H, d, $J=1.5\text{ Hz}$)

参考製造例6



水素化ナトリウム（60%油性）11.2 gと1, 4-ジオキサン140 mlとの混合物に、60℃でマロン酸ジエチル44.8 gを滴下した後、臭化銅（I）20.4 gと2-ブロモフルオロベンゼン24.5 gとを順次加え、22時間加熱還流した。反応混合物に氷冷下濃塩酸を加えた後、tert-ブチルメチルエーテルと水とを加え、分液した。有機層を希塩酸、10%水酸化ナトリウム水溶液、希塩酸、水で順次洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮した。残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付し、（2-フルオロフェニル）マロン酸ジエチル17.6 gを得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 1.27 (6H, m), 4.2–4.3 (4H, m), 4.97 (1H, s), 7.08 (1H, m), 7.16 (1H, m), 7.3–7.4 (1H, m), 7.47 (1H, m)

（2-フルオロフェニル）マロン酸ジエチル17.0 g、2-アミノイミダゾール硫酸塩10.6 g、DBU22.4 gおよびN, N-ジメチルホルムアミド40 mlの混合物を100℃で8時間加熱した。反応混合物に水を加え、室温まで放冷した後、tert-ブチルメチルエーテルとで分液した。水層に濃塩酸を加え、析出した沈殿を濾取、乾燥して5, 7-ジヒドロキシー6-（2-フルオロフェニル）イミダゾ[1, 2-a]ピリミジン12.3 gを得た。

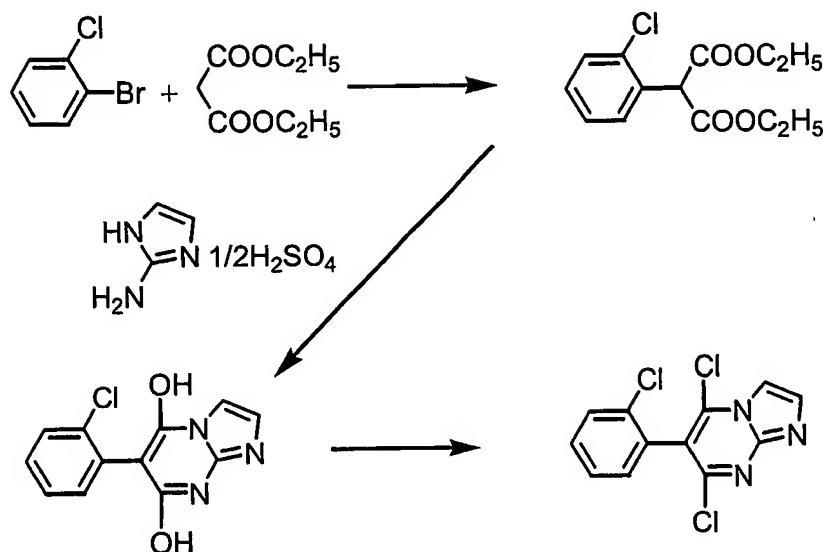
$^1\text{H-NMR}$ ($\text{DMSO}-d_6$, TMS) δ (ppm): 7.1–7.2 (2H, m), 7.2–7.4 (2H, m), 7.39 (1H, d, $J=2.7\text{ Hz}$), 7.50 (1H, d, $J=2.4\text{ Hz}$), 12.6 (br s)

5, 7-ジヒドロキシー6-（2-フルオロフェニル）イミダゾ[1, 2-a]ピリミジン7.36 g、DBU5.02 gおよびオキシ塩化リン30 mlとの混合物を、還流条件下11時間加熱した。反応混合物を濃縮した後、残渣にクロロホルムと飽和炭酸水素ナトリウム水溶液とを加え、分液した。有機層を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、5, 7-ジクロロ6-（2-フルオロフェニル）イミダゾ[1, 2-a]ピリミジン1.70 gを得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 7.2–7.3 (1

H, m), 7.3–7.4 (2H, m), 7.5–7.6 (1H, m), 7.73 (1H, d, $J=1.4$ Hz), 7.89 (1H, d, $J=1.5$ Hz)

参考製造例 7



- 5 水素化ナトリウム（60%油性）12.0 gと1,4-ジオキササン150 mlとの混合物に、60℃でマロン酸ジエチル48.1 gを滴下した後、臭化銅（I）21.9 gと2-ブロモクロロベンゼン28.7 gとを順次加え、18時間加熱還流した。反応混合物に氷冷下濃塩酸を加えた後、tert-ブチルメチルエーテルと水とを加え、分液した。有機層を希塩酸、10%水酸化ナトリウム水溶液、希塩酸、水で順次洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮した。残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付し、（2-クロロフェニル）マロン酸ジエチル24.3 gを得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, TMS) δ (ppm): 1.28 (6H, t, $J=7.1$ Hz), 4.25 (4H, m), 5.21 (1H, s), 7.2–7.3 (2H, m), 7.3–7.4 (1H, m), 7.4–7.5 (1H, m)

- （2-クロロフェニル）マロン酸ジエチル17.1 g、2-アミノイミダゾール硫酸塩10 g、DBU21.1 gおよびN,N-ジメチルホルムアミド40 mlの混合物を100℃で10時間加熱した。反応混合物に水を加え、室温まで放冷した後、tert-ブチルメチルエーテルとで分液した。水層に濃塩酸を加え、析出した沈殿を濾取、乾燥して5,7-ジヒドロキシ-6-（2-クロロフェニル）

イミダゾ [1, 2-a] ピリミジン 12.1 g を得た。

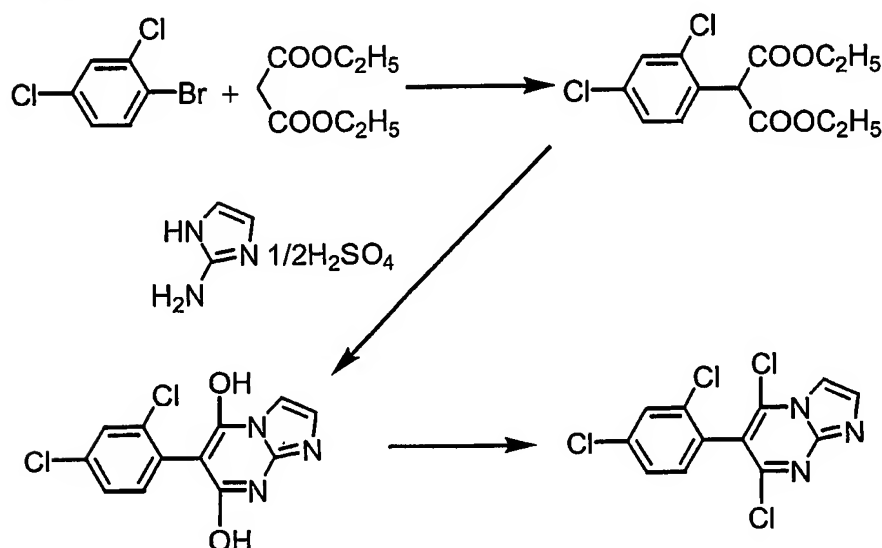
$^1\text{H-NMR}$ (DMSO-d_6 , TMS) δ (ppm): 7.2–7.3 (3H, m), 7.38 (1H, d, $J=2.6\text{ Hz}$), 7.4–7.5 (1H, m), 7.49 (1H, d, $J=2.4\text{ Hz}$), 12.5 (br s)

- 5 5, 7-ジヒドロキシ-6-(2-クロロフェニル) イミダゾ [1, 2-a] ピリミジン 6.54 g、DBU 4.12 g およびオキシ塩化リン 25 ml との混合物を、還流条件下 4 時間加熱した。反応混合物を濃縮した後、残渣にクロロホルムと飽和炭酸水素ナトリウム水溶液とを加え、分液した。有機層を水洗し、硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮した。残渣をエチレングリコールジメチルエー
- 10 テルで洗浄し、5, 7-ジクロロ-6-(2-クロロフェニル) イミダゾ [1, 2-a] ピリミジン 5.87 g を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 7.32 (1H, d, $J=1.7\text{ Hz}$, 7.6 Hz), 7.4–7.5 (2H, m), 7.58 (1H, dd, $J=1.3\text{ Hz}$, 7.9 Hz), 7.73 (1H, d, $J=1.5\text{ Hz}$)

15), 7.90 (1H, d, $J=1.7\text{ Hz}$)

参考製造例 8



- 水素化ナトリウム (60%油性) 10.0 g と 1, 4-ジオキサソ 130 ml との混合物に、60℃でマロン酸ジエチル 40.0 g を滴下した後、臭化銅 (I)
- 20) 18.2 g と 1-ブロモ-2, 4-ジクロロベンゼン 25.0 g とを順次加え

、17時間加熱還流した。反応混合物に氷冷下濃塩酸を加えた後、tert-ブチルメチルエーテルと水とを加え、分液した。有機層を希塩酸、10%水酸化ナトリウム水溶液、希塩酸、水で順次洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮した。残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付し、(2,4-ジクロロフェニル

5) マロン酸ジエチル 28.4 g を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 1.2–1.3 (6 H, m), 4.2–4.4 (4 H, m), 5.15 (1 H, s), 7.2–7.3 (1 H, m), 7.4–7.5 (2 H, m)

(2,4-ジクロロフェニル) マロン酸ジエチル 9.62 g、2-アミノイミ
10 ダゾール硫酸塩 5.0 g、DBU 10.5 g および N,N-ジメチルホルムアミ
ド 25 ml の混合物を 100°C で 10 時間加熱した。反応混合物に水を加え、室
温まで放冷した後、tert-ブチルメチルエーテルとで分液した。水層に濃塩酸を加
え、析出した沈殿を濾取、乾燥して 5,7-ジヒドロキシー-6-(2,4-ジク
ロロフェニル) イミダゾ [1,2-a] ピリミジン 7.0 g を得た。

15 $^1\text{H-NMR}$ ($\text{DMSO}-d_6$, TMS) δ (ppm): 7.31 (1 H, d, $J=8.3\text{ Hz}$), 7.35–7.40 (2 H, m), 7.48 (1 H, d, $J=3.5\text{ Hz}$), 7.58 (1 H, d, $=2.1\text{ Hz}$), 11.8 (b r s)

5,7-ジヒドロキシー-6-(2,4-ジクロロフェニル) イミダゾ [1,2-
-a] ピリミジン 7.0 g、DBU 3.95 g および オキシ塩化リン 25 ml と
20 の混合物を、還流条件下 5 時間加熱した。反応混合物を濃縮した後、残渣にクロ
ロホルムと飽和炭酸水素ナトリウム水溶液とを加え、分液した。有機層を飽和炭
酸水素ナトリウム水溶液、飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した
後、濃縮した。残渣をクロロホルムで洗浄し、5,7-ジクロロ-6-(2,4-
ジクロロフェニル) イミダゾ [1,2-a] ピリミジン 2.17 g を得た。

25 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 7.27 (1 H, d, $J=8.9\text{ Hz}$), 7.43 (1 H, dd, $J=1.9\text{ Hz}$, 8.2 Hz), 7.60 (1 H, d, $J=2.1\text{ Hz}$), 7.73 (1 H, d, $J=1.4\text{ Hz}$), 7.90 (1 H, d, $J=1.7\text{ Hz}$)

次に製剤例を示す。なお、部は重量部を表す。

製剤例 1

- 本発明化合物 (1) ~ (24) の各々 50 部、リグニンスルホン酸カルシウム 3 部、ラウリル硫酸マグネシウム 2 部及び合成含水酸化珪素 45 部をよく粉碎混合することにより、各々の水和剤を得る。

製剤例 2

- 本発明化合物 (1) ~ (24) の各々 20 部とソルビタントリオレート 1.5 部とを、ポリビニルアルコール 2 部を含む水溶液 28.5 部と混合し、湿式粉碎法で微粉碎した後、この中に、キサンタンガム 0.05 部及びアルミニウムマグネシウムシリケート 0.1 部を含む水溶液 40 部を加え、さらにプロピレングリコール 10 部を加えて攪拌混合し各々のフロアブル製剤を得る。

製剤例 3

- 本発明化合物 (1) ~ (24) の各々 2 部、カオリンクレー 88 部及びタルク 10 部をよく粉碎混合することにより、各々の粉剤を得る。

15 製剤例 4

本発明化合物 (1) ~ (24) の各々 5 部、ポリオキシエチレンスチリルフェニルエーテル 14 部、ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム 6 部及びキシレン 75 部をよく混合することにより、各々の乳剤を得る。

製剤例 5

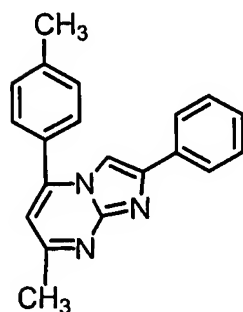
- 20 本発明化合物 (1) ~ (24) の各々 2 部、合成含水酸化珪素 1 部、リグニンスルホン酸カルシウム 2 部、ベントナイト 30 部及びカオリンクレー 65 部をよく粉碎混合した後、水を加えてよく練り合せ、造粒乾燥することにより、各々の粒剤を得る。

製剤例 6

- 25 本発明化合物 (1) ~ (24) の各々 10 部、ポリオキシエチレンアルキルエーテルサルフェートアンモニウム塩 50 部を含むホワイトカーボン 35 部及び水 55 部を混合し、湿式粉碎法で微粉碎することにより、各々の製剤を得る。

次に本発明化合物が植物病害の防除に有効であることを、試験例により示す。

比較の為に日本公開特許公報の特開2001-43978の第17頁のA-74、
即ち2-フェニル-5-(4-メチルフェニル)-7-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリミジン（以下、比較化合物Aと記す。）も、同様に試験に供した。



比較化合物A

5 試験例 1

プラスチックポットに砂壤土を詰め、キュウリ（相模半白）を播種し、温室内で10日間生育させた。製剤例6に準じて得られた本発明化合物（1）～（24）および比較化合物Aの製剤の各々を、水で500ppmの濃度に希釈し、散布液を調製した。各々の散布液を、前記のキュウリ子葉面に十分付着するように茎葉散布した。葉面上の散布液を風乾させた後、キュウリの子葉面上に灰色かび病菌の胞子を含むPDA培地を置いた。そのキュウリを12℃多湿下に5日間放置した後、植物の病斑面積を肉眼にて観察した。無処理の植物の病斑面積と、薬剤を処理した植物の病斑面積を比較し、病害の防除効果を判定した。

その結果、本発明化合物（1）～（24）を有効成分とする散布液で処理したキュウリの病斑面積は、無処理区の病斑面積の30%以下であった。比較化合物を含む散布液で処理したキュウリの病斑面積は、無処理区の病斑面積の75%以上であった。

試験例 2

ジメチルスルホキシドに溶解した比較化合物Aおよび化合物22の各々を所定濃度（2ppm）になるようにPDA培地に混合し、滅菌シャーレ中に注ぎ入れ平板培地を作成した。作成した培地の中央に灰色かび病菌の菌糸片を接種し18℃で60時間培養した後、菌叢半径を測定した。その結果、化合物22添加のPDA培地における菌叢半径は無添加PDA培地における菌叢半径の10%以下であった。比較化合物A添加のPDA培地における菌叢半径は無添加PDA培地に

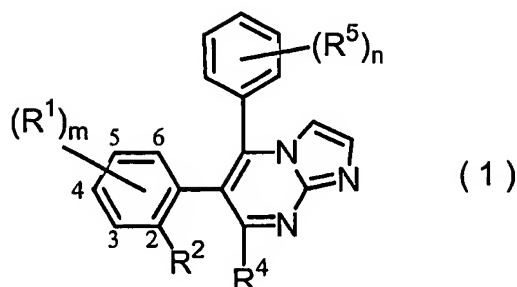
おける菌叢半径の80%以上であった。

産業上の利用可能性

本発明化合物を用いることにより、植物病害を防除することができる。

請求の範囲

1. 下式 (1)



[式中、 R^1 および R^2 はハロゲン原子を表し、 R^4 はハロゲン原子、C1-C4アルキル基、C1-C4アルコキシ基またはシアノ基を表し、 R^5 はハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、C1-C4アルキル基、C1-C4アルコキシ基、C1-C4アルキルチオ基、C1-C4ハロアルキルチオ基、C1-C4ハロアルキル基、C1-C4ハロアルコキシ基、C1-C4アシル基、C2-C5アルコキシカルボニル基またはフェニル基を表し、 m は0~4の整数を表し、 n は0~5の整数を表す。 m が2以上の整数の場合、 R^1 は互いに同一または相異なる原子を表してもよく、 n が2以上の整数の場合、 R^5 は互いに同一または相異なる原子または基を表してもよい。]

で示されるイミダゾピリミジン化合物。

2. 式(1)において、 m が0~2の整数である請求項1に記載のイミダゾピリミジン化合物。

3. 式(1)において、 m が0であるか、 m が1であり、 R^1 が4位で置換したハロゲン原子である請求項1に記載のイミダゾピリミジン化合物。

4. 式(1)において、 m が0であるか、 m が1であり、 R^1 が4位もしくは6位で置換したハロゲン原子であるか、あるいは、 m が2であり、ひとつの R^1 が4位で置換したハロゲン原子であり、もうひとつの R^1 が6位で置換したハロゲン原子である請求項1に記載のイミダゾピリミジン化合物。

5. 式(1)において、 m が1または2であり、少なくともひとつの R^1 が4位もしくは6位で置換したハロゲン原子である請求項1に記載のイミダゾピリミジン化合物。

6. 式(1)において、 m が1であり、 R^1 が6位で置換したハロゲン原子であるか、あるいは、 m が2であり、ひとつの R^1 が4位で置換したハロゲン原子であり、もうひとつの R^1 が6位で置換したハロゲン原子である請求項1に記載のイミダゾピリミジン化合物。
- 5 7. 式(1)において、 m が1であり、 R^1 が6位で置換したフッ素原子または6位で置換した塩素原子であるか、あるいは、 m が2であり、ひとつの R^1 が4位で置換したフッ素原子または4位で置換した塩素原子であり、もうひとつの R^1 が6位で置換したフッ素原子または6位で置換した塩素原子であり、更に R^2 がフッ素原子または塩素原子である請求項1に記載のイミダゾピリミジン化合物。
- 10 8. 式(1)において、 R^1 および R^2 がそれぞれ独立してフッ素原子または塩素原子である請求項1に記載のイミダゾピリミジン化合物。
9. 式(1)において、 R^4 がハロゲン原子またはC1-C4アルキル基である請求項1～8のいずれかに記載のイミダゾピリミジン化合物。
10. 式(1)において、 R^4 がハロゲン原子である請求項1～8のいずれかに記載のイミダゾピリミジン化合物。
- 15 11. 請求項1に記載のイミダゾピリミジン化合物を有効成分として含有する殺菌組成物。
12. 殺菌組成物の有効成分としての、請求項1に記載のイミダゾピリミジン化合物の使用。
- 20 13. 請求項1に記載のイミダゾピリミジン化合物を、植物または植物を栽培する土壤に施用する植物病害の防除方法。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP03/02014

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

Int.Cl⁷ C07D487/04, A01N43/90

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

Int.Cl⁷ C07D487/04, A01N43/90

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)

CA (STN), REGISTRY (STN), WPIDS (STN)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	WO 97/42192 A (BASF AG.), 13 November, 1997 (13.11.97), Full text & EP 1136477 A	1-13

☐ Further documents are listed in the continuation of Box C.

☐ See patent family annex.

* Special categories of cited documents:

"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

"E" earlier document but published on or after the international filing date

"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"I" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art

"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search
01 April, 2003 (01.04.03)

Date of mailing of the international search report
22 April, 2003 (22.04.03)

Name and mailing address of the ISA/
Japanese Patent Office

Authorized officer

Facsimile No.

Telephone No.

A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (IPC))
Int. Cl⁷ C07D487/04, A01N43/90

B. 調査を行った分野

調査を行った最小限資料 (国際特許分類 (IPC))
Int. Cl⁷ C07D487/04, A01N43/90

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

国際調査で使用した電子データベース (データベースの名称、調査に使用した用語)

CA (STN), REGISTRY (STN), WPIDS (STN)

C. 関連すると認められる文献

引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
A	WO 97/42192 A (BASF AKTIENGESELLSCHAFT) 1997. 11. 13, 文献全体 & EP 1136477 A	1-13

☐ C欄の続きにも文献が列挙されている。

☐ パテントファミリーに関する別紙を参照。

* 引用文献のカテゴリー

「A」 特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの

「E」 国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの

「L」 優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献 (理由を付す)

「O」 口頭による開示、使用、展示等に言及する文献

「P」 国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願

の日の後に公表された文献

「T」 国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの

「X」 特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの

「Y」 特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの

「&」 同一パテントファミリー文献

国際調査を完了した日
01.04.03

国際調査報告の発送日
22.04.03

国際調査機関の名称及びあて先
日本国特許庁 (ISA/J P)
郵便番号100-8915
東京都千代田区霞が関三丁目4番3号

特許庁審査官 (権限のある職員)
内藤 伸一



4 P 8615

電話番号 03-3581-1101 内線 3492